

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2004-137208

(43)Date of publication of application : 13.05.2004

(51)Int.Cl. C07F 9/6553  
 // A61K 31/661  
 A61K 31/662  
 A61P 37/06

(21)Application number : 2002-304196

(71)Applicant : SANKYO CO LTD

(22)Date of filing : 18.10.2002

(72)Inventor : NISHI TAKEHIDE

SHIMOZATO RYUICHI

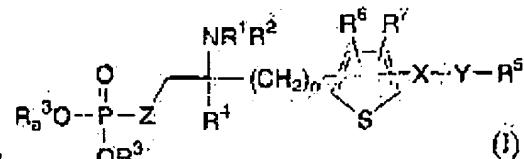
NARA FUTOSHI

## (54) PHOSPHORIC ACID OR PHOSPHONIC ACID DERIVATIVE

## (57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a phosphoric acid or phosphonic acid derivative, pharmacologically acceptable salts or esters thereof, all having high immunosuppressive activity.

SOLUTION: The phosphoric acid or phosphonic acid derivative is represented by formula(I) (wherein, R1 and R2 are each H, or the like; R3 and R4 are each H or a phosphate group-protecting group; R4 is H, a lower alkyl, or the like; (n) is 1-6; X is ethylene group, or the like; Y is a single bond, a 1-10C alkylene group, or the like; Z is O or methylene group; R5 is H, a cycloalkyl, an aryl, or the like; R6 and R7 are each H, a halogen atom, or the like; wherein, when R5 is H, Y is a substituted 1-10C alkylene group, or the like). The pharmacologically acceptable salts or esters of the phosphoric acid or phosphonic acid derivative are also provided, respectively.



(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2004-137208

(P2004-137208A)

(43) 公開日 平成16年5月13日(2004.5.13)

(51) Int.CI.<sup>7</sup>  
**C07F 9/6553**  
 // **A61K 31/661**  
**A61K 31/662**  
**A61P 37/06**

**F1**  
**C07F 9/6553**  
**A61K 31/661**  
**A61K 31/662**  
**A61P 37/06**

テーマコード (参考)  
**4C086**  
**4H050**

審査請求 未請求 請求項の数 44 O L (全 199 頁)

(21) 出願番号 特願2002-304196 (P2002-304196)  
 (22) 出願日 平成14年10月18日 (2002.10.18)

(71) 出願人 000001856  
 三共株式会社  
 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号  
 (74) 代理人 100081400  
 弁理士 大野 彰夫  
 (74) 代理人 100092716  
 弁理士 中田 ▲やす▼雄  
 (74) 代理人 100115750  
 弁理士 矢口 敏昭  
 (74) 代理人 100119622  
 弁理士 金原 玲子  
 (72) 発明者 西 剛秀  
 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共  
 株式会社内

最終頁に続く

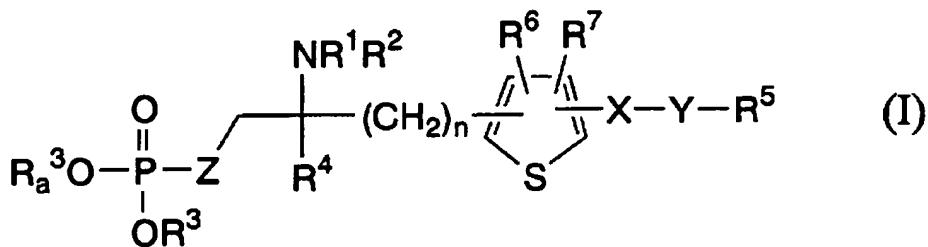
(54) 【発明の名称】 リン酸又はホスホン酸誘導体

(57) 【要約】

【課題】 本発明は、優れた免疫抑制作用を有するリン酸又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルに関する。

【解決手段】 一般式 (I p)

【化1】



10

[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> : H等；R<sup>3</sup>、R<sup>a</sup><sup>3</sup> : H、リン酸基の保護基；R<sup>4</sup> : H、低級アルキル基等；n : 1乃至6；X : エチレン基等；Y : 単結合、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基等；Z : 酸素原子、メチレン基；R<sup>5</sup> : H、シクロアルキル基、アリール基等；R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> : H、ハロゲン原子等；但し、R<sup>5</sup> が水素原子であるとき、Yは置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基等を示す。] を有するリン酸又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

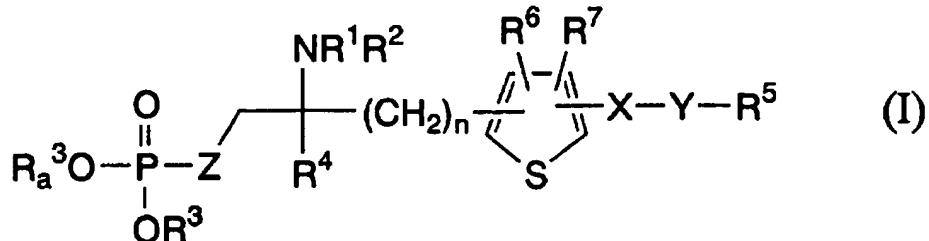
20

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

一般式 (I)

## 【化 1】



〔式中、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R<sup>3</sup> 及び R<sup>a3</sup> は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示し、

R<sup>4</sup> は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ低級アルキル基を示し、

n は、1 乃至 6 の整数を示し、

X は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式-D-CH<sub>2</sub>-を有する基 (式中、D は、カルボニル基、式-CH(OH)-を有する基、酸素原子、硫黄原子又は式-NH-を有する基を示す。)、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリーレン基又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリーレン基を示し、

Y は、単結合、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基を示し、

Z は、酸素原子又はメチレン基を示し、

R<sup>5</sup> は、水素原子、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> シクロアルキル基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリール基、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> シクロアルキル基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリール基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基を示し、

R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 a から選択される基を示し、置換基群 a は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ-低級アルキルアミノ基、ジ-低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

置換基群 b は、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> シクロアルキル基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリール基、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> アリール基並びに置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

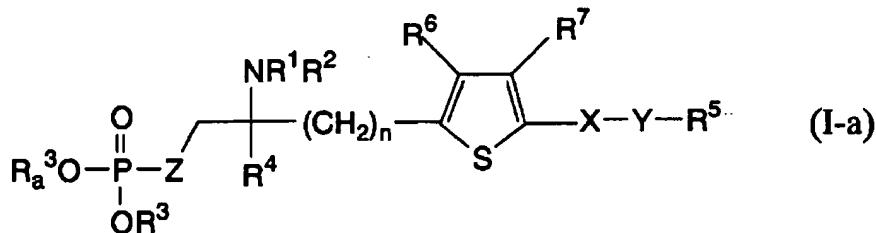
但し、R<sup>5</sup> が水素原子であるとき、Y は、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> アルキレン基を示す。】

を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

【請求項 2】

請求項 1において、式 (I) を有する化合物が、式 (I-a)

【化 2】

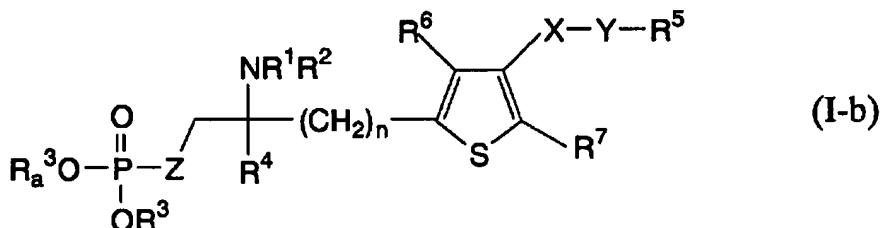


を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

【請求項 3】

請求項 1において、式 (I) を有する化合物が、式 (I-b)

【化 3】



を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

【請求項 4】

請求項 1乃至 3 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、同一又は異なって、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 脂肪族アシル基又はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 5】

請求項 1乃至 3 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、同一又は異なって、水素原子又はC<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> 脂肪族アシル基又はC<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 6】

請求項 1乃至 3 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 7】

請求項 1乃至 3 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

30

【請求項 8】

請求項 1乃至 7 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>3</sup> 及び R<sup>3</sup>a が、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基又はアラルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1乃至 7 から選択されるいずれか 1 項において、

R<sup>3</sup> 及び R<sup>3</sup>a が、同一又は異なって、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 10】

請求項 1乃至 7 から選択されるいずれか 1 項において、

40

50

$R^3$  及び  $R^3 a$  が、同一又は異なって、水素原子又は  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 1】

請求項 1 乃至 7 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^3$  及び  $R^3 a$  が、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 2】

請求項 1 乃至 7 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^3$  及び  $R^3 a$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

10

【請求項 1 3】

請求項 1 乃至 1 2 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^4$  が、 $C_1 - C_4$  アルキル基又はヒドロキシ  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 4】

請求項 1 乃至 1 2 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^4$  が、 $C_1 - C_2$  アルキル基又はヒドロキシ  $C_1 - C_2$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 5】

請求項 1 乃至 1 2 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^4$  が、 $C_1 - C_2$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

20

【請求項 1 6】

請求項 1 乃至 1 2 から選択されるいずれか 1 項において、

$R^4$  が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 7】

請求項 1 乃至 1 6 から選択されるいずれか 1 項において、

$n$  が、2 又は 3 である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 1 8】

請求項 1 乃至 1 6 から選択されるいずれか 1 項において、

$n$  が、2 である化合物又はその薬理上許容される塩。

30

【請求項 1 9】

請求項 1 乃至 1 8 から選択されるいずれか 1 項において、

$X$  が、エチレン基、エチニレン基、式  $-D - CH_2 -$  を有する基 [式中、 $D$  は、カルボニル基又は式  $-CH(OH)$  を有する基を示す。]、フェニレン基、ナフチレン基、又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換されたフェニレン基若しくはナフチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 0】

請求項 1 乃至 1 8 から選択されるいずれか 1 項において、

$X$  が、エチレン基、エチニレン基、式  $-CO - CH_2 -$  を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で 1 乃至 3 個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

40

【請求項 2 1】

請求項 1 乃至 1 8 から選択されるいずれか 1 項において、

$X$  が、エチレン基、エチニレン基又は式  $-CO - CH_2 -$  を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 2】

請求項 1 乃至 2 1 から選択されるいずれか 1 項において、

$Y$  が、 $C_1 - C_{10}$  アルキレン基又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1 - C_{10}$  アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項 2 3】

請求項 1 乃至 2 1 から選択されるいずれか 1 項において、

50

YがC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項24】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

YがC<sub>1</sub> - C<sub>5</sub>アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>5</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項25】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換されたエチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。 10

【請求項26】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項27】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項28】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。 20

【請求項29】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項30】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。 30

【請求項31】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項32】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、式-O-CH<sub>2</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-又は-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。 40

【請求項33】

請求項1乃至21から選択されるいずれか1項において、

Yが、式-CH<sub>2</sub>-O-又は-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項34】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

【請求項35】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基、硫黄原子、酸素原子 50

及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>—C<sub>10</sub>シクロアルキル基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩。

## 【請求項36】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、C<sub>3</sub>—C<sub>10</sub>シクロアルキル基、C<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>—C<sub>10</sub>シクロアルキル基若しくはC<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩。 10

## 【請求項37】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、C<sub>3</sub>—C<sub>10</sub>シクロアルキル基、C<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>—C<sub>10</sub>シクロアルキル基若しくはC<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩。

## 【請求項38】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、C<sub>5</sub>—C<sub>6</sub>シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。 20

## 【請求項39】

請求項1乃至33から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

## 【請求項40】

請求項1乃至39から選択されるいずれか1項において、

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩。

## 【請求項41】

請求項1乃至39から選択されるいずれか1項において、

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。 30

## 【請求項42】

請求項1乃至41から選択されるいずれか1項において、

Zが、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

## 【請求項43】

請求項1において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩：

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、 40

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、 50

リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルシクロヘキシオキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロピニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルメトキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントタノイル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペントタノイル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペントタノイル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントチル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントタノイル)チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
リソ酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル及び  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル。

## 【請求項 4 4】

請求項 1において、下記より選択されるいずれか 1 つの化合物又はその薬理上許容される塩：

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸及び  
 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

## 【発明の属する技術分野】

本発明は、優れた免疫抑制作用を有するリン酸若しくはホスホン酸誘導体、リン酸若しくはホスホン酸誘導体の薬理上許容される塩又はリン酸若しくはホスホン酸誘導体のエステ

ル、或いはそれらを有効成分として含有する医薬組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】

従来、リウマチやその他の自己免疫疾患等の免疫関連病の治療においては、異常な免疫反応によって生じる炎症反応に対してステロイドなどの抗炎症薬が使用されてきた。しかしながらこれらは対症療法であり根本的治療法ではない。

【0003】

また、糖尿病、腎炎の発症においても免疫系の異常が関与することは報告されているが（例えば、非特許文献1参照）、[Kidney International, 51, 94 (1997); Journal of Immunology, 157, 104691 (1996)]、その異常を改善するような薬剤の開発には至っていない。

【0004】

一方、免疫応答を抑制する方法の開発は、臓器及び細胞移植における拒絶反応を防いだり、種々の自己免疫疾患を治療及び予防する上でも極めて重要である。しかしながら、シクロスボリンA (CsA) やタクロリムス (TRL) 等の従来知られている免疫抑制剤は、腎臓及び肝臓に対して毒性を示すことが知られており、そのような副作用を軽減するために、ステロイド類を併用するなどの治療が広く用いられてきたが、必ずしも副作用を示すことなく十分な免疫抑制効果を発揮するには至っていないのが現状である。

【0005】

このような背景から、毒性が低く、優れた免疫抑制作用を有する化合物を見出すことが試みられている。

【0006】

免疫抑制剤として、例えば、WO94/08943号公報 (EP627406号公報)、WO96/06068号公報、WO98/45249号公報に記載されるアミノアルコール誘導体や、WO02/18395号公報に記載されるリン酸エステル誘導体が知られている。しかしながら、いずれの公報にも、本発明の化合物は開示されていない。

【0007】

一方、上記一般式 (I) において、Z = O である本発明の化合物は、WO02/06268号公報において、ヒドロキシ化合物の保護基がリン酸エステル塩残基である化合物として開示されている。

30

【0008】

【特許文献1】

WO94/08943号公報 (EP627406号公報) (第371頁)

【特許文献2】

WO96/06068号公報 (第271頁)

【特許文献3】

WO98/45249号公報 (第81頁)

【特許文献4】

WO02/06268号公報 (第345頁)

【非特許文献1】

Kidney International, vol. 51, 94 (1997); Journal of Immunology, vol. 157, 104691 (1996)

40

【0009】

【発明が解決しようとする課題】

上記一般式 (I) を有する本発明の化合物が、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有し、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬

50

、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、尋常、Sydenham舞蹈病、全身性硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、さらに、真菌、マイコプラズマ、ウイルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞蹈病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患（特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患）に有用であることを見出し、本発明を完成した。

10

## 【0010】

従って、本発明は、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有するリン酸若しくはホスホン酸誘導体、リン酸若しくはホスホン酸誘導体の薬理上許容される塩又はリン酸若しくはホスホン酸誘導体の薬理上許容されるエステル、或いはそれらを有効成分として含有する医薬組成物を提供することである。

20

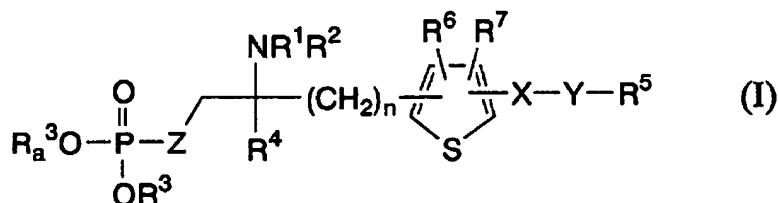
## 【0011】

## 【課題を解決するための手段】

(1) 本発明のリン酸又はホスホン酸誘導体は、下記一般式(I)を有する。

## 【0012】

## 【化4】



30

## 【0013】

上記式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>a3</sup>は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示し、

R<sup>4</sup>は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ低級アルキル基を示し、

nは、1乃至6の整数を示し、

40

Xは、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式-D-CH<sub>2</sub>-を有する基（式中、Dは、カルボニル基、式-CH(OH)-を有する基、酸素原子、硫黄原子又は式-NH-を有する基を示す。）、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーレン基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーレン基を示し、

Yは、単結合、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基を示し、

Zは、酸素原子又はメチレン基を示し、

50

$R^5$  は、水素原子、 $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6 - C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_6 - C_{10}$  アリール基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群aから選択される基を示し、置換基群aは、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノー低級アルキルアミノ基、ジー低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

10

置換基群bは、 $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6 - C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された $C_6 - C_{10}$  アリール基、及び置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基からなる群を示す。

## 【0014】

但し、 $R^5$  が水素原子であるとき、Yは、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1 - C_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1 - C_{10}$  アルキレン基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1 - C_{10}$  アルキレン基を示す。

20

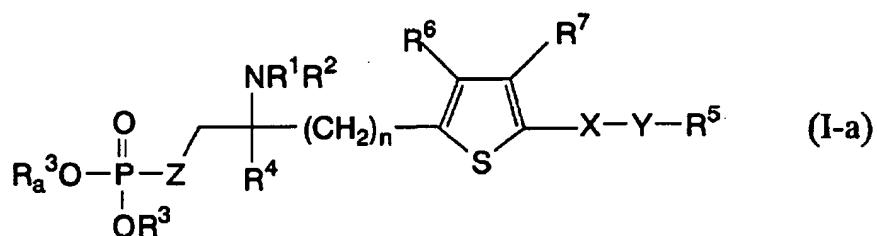
## 【0015】

本発明は、式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルである。

(2) (1)において、式(I)を有する化合物が、式(I-a)

## 【0016】

## 【化5】



## 【0017】

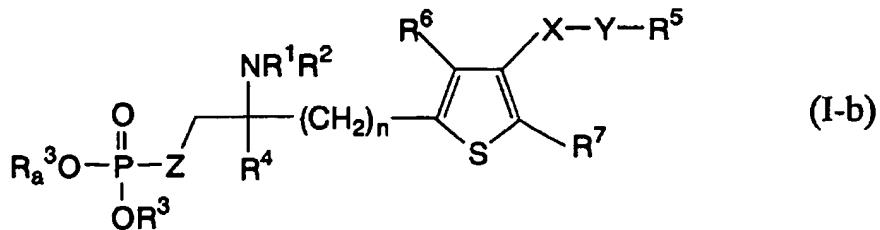
[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、X、Y、Z及びnは、(1)におけるものと同意義を示す。]を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル、

40

(3) (1)において、式(I)を有する化合物が、式(I-b)

## 【0018】

## 【化6】



## 【0019】

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X、Y、Z及びnは、請求項1におけるものと同意義を示す。)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル、

(4) (1)乃至(3)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、同一又は異なって、水素原子、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>脂肪族アシル基又はC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、(5) (1)乃至(3)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、同一又は異なって、水素原子又はC<sub>1</sub>—C<sub>2</sub>脂肪族アシル基又はC<sub>1</sub>—C<sub>2</sub>低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(6) (1)乃至(3)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(7) (1)乃至(3)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(8) (1)乃至(7)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>3</sup>及びR<sup>3</sup>aが、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基又はアラルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(9) (1)乃至(7)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>3</sup>及びR<sup>3</sup>aが、同一又は異なって、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(10) (1)乃至(7)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>3</sup>及びR<sup>3</sup>aが、同一又は異なって、水素原子又はC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(11) (1)乃至(7)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>3</sup>及びR<sup>3</sup>aが、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(12) (1)乃至(7)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>3</sup>及びR<sup>3</sup>aが、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(13) (1)乃至(12)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基又はヒドロキシC<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(14) (1)乃至(12)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub>—C<sub>2</sub>アルキル基又はヒドロキシC<sub>1</sub>—C<sub>2</sub>アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(15) (1)乃至(12)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub>—C<sub>2</sub>アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(16) (1)乃至(12)から選択されるいずれか1項において、

R<sup>4</sup>が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(17) (1)乃至(16)から選択されるいずれか1項において、

nが、2又は3である化合物又はその薬理上許容される塩、

(18) (1)乃至(16)から選択されるいずれか1項において、

30

40

50

nが、2である化合物又はその薬理上許容される塩、

(19) (1)乃至(18)から選択されるいずれか1項において、

Xが、エチレン基、エチニレン基、式-D-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-を有する基〔式中、Dは、カルボニル基又は式-C<sub>1</sub>H(OH)-を有する基を示す。〕、フェニレン基、ナフチレン基、又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基若しくはナフチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(20) (1)乃至(18)から選択されるいずれか1項において、

Xが、エチレン基、エチニレン基、式-CO-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

10

(21) (1)乃至(18)から選択されるいずれか1項において、

Xが、エチレン基、エチニレン基又は式-CO-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(22) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(23) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

YがC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(24) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

20

YがC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(25) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基又は1個のヒドロキシ基で置換された、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(26) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(27) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

30

Yが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(28) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(29) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(30) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

40

(31) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(32) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、式-O-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-、-O-(C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-O-(C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-O-、-(C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-又は-(C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(33) (1)乃至(21)から選択されるいずれか1項において、

Yが、式-C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>-O-又は-(C<sub>1</sub>H<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-を有する基である化合物又はその薬理

50

上許容される塩、

(34) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^5$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(35) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^5$  が、 $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6 - C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6 - C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(36) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

10

$R^5$  が、 $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6 - C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基若しくは  $C_6 - C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(37) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^5$  が、 $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6 - C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基で 1 乃至 3 個の置換基で置換された  $C_3 - C_{10}$  シクロアルキル基若しくは  $C_6 - C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩、

20

(38) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^5$  が、 $C_5 - C_6$  シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(39) (1) 乃至 (33) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^5$  が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(40) (1) 乃至 (39) から選択されるいずれか 1 項において、

$R^6$  及び  $R^7$  が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(41) (1) 乃至 (39) から選択されるいずれか 1 項において、

30

$R^6$  及び  $R^7$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(42) (1) 乃至 (41) から選択されるいずれか 1 項において、

$Z$  が、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(43) (1) において、下記より選択されるいずれか 1 つの化合物又はその薬理上許容される塩：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

40

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イ

50

ニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)  
 チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-  
 イニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)  
 チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペ  
 ント-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メトキシフェニル)ペ 10  
 ント-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルシクロヘキシ  
 オキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルフェノキシ) プ  
 ロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エチルフェノキシ) プ  
 ロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルチオフェノキシ  
 ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト- 20  
 1-イニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)  
 ブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルフェノキシ) ブ  
 ト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロ  
 ピニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルメトキシブト-1-  
 イニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル): 30  
 チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル) チオフ  
 エン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントノイル)  
 チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペントノイル) チオ  
 フェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペ 40  
 ンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントル) チ  
 オフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-  
 イニル) チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペントノイル)  
 チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-クロロフェノキシ) プ  
 ロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メチルフェノキシ) プ  
 ロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキ 50

シ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メトキシフェノキシ)  
 プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3, 4-ジメトキシフェノ  
 キシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3, 5-ジメトキシフェノ  
 キシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-アセチルフェノキシ)  
 プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル及び  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-アセチルフェノキシ) 10  
 プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル。  
 (44) (1)において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許  
 容される塩：  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル) チオフェン-2-イ  
 ル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル) チオフェン-2-  
 イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル) チオフェン-  
 2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル) チオフェン- 20  
 2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ) ブチル] チオフ  
 エン-2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ) ブチル] チオフ  
 エン-2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブチル) チオフェン-2-イ  
 ル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル) チオフェン-2  
 -イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブタノイル) チオフェン-2-イル 30  
 ] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル) チオフェン-  
 2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イ  
 ル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-フルオロフェニル) ペンタノイル] チ  
 オフェン-2-イル] ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル) チオフェン-2-  
 イル] ペンチルホスホン酸及び  
 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル) チオフェン- 40  
 2-イル] ペンチルホスホン酸。

## 【0020】

上記化合物(I)において、(2)乃至(3)；(4)乃至(7)；(8)乃至(12)  
 ；(13)乃至(16)；(17)乃至(18)；(19)乃至(21)；(22)乃至  
 (33)；(34)乃至(39)；(40)乃至(41)；並びに(42)から成る群か  
 ら選択されるいずれか一項を任意に組み合わせた化合物も好適である。

## 【0021】

上記式(I)中、R<sup>5</sup>及び置換基群bの定義における「C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基」、「置  
 換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基」及び「置換  
 基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基」のアリ 50

一郎部分は、例えば、フェニル、インデニル又はナフチルであり得、好適には、フェニル又はナフチル基であり、最も好適には、フェニル基である。

〔 0 0 2 2 〕

Xの定義における「C<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリーレン基」、「置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリーレン基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>—C<sub>10</sub>アリーレン基」のアリーレン部分は、例えば、フェニレン、インデニレン又はナフチレンであり得、好適には、フェニレン又はナフチレン基であり、最も好適には、フェニレン基である。

[ 0 0 2 3 ]

Yの定義における「C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基」のC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン部分は、例えば、メチレン、メチルメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、1-メチルエチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、3-メチルトリメチレン、1-メチルプロピレン、1, 1-ジメチルエチレン、ペンタメチレン、1-メチルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、3-メチルテトラメチレン、4-メチルテトラメチレン、1, 1-ジメチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、3, 3-ジメチルトリメチレン、ヘキサメチレン、1-メチルペンタメチレン、2-メチルペンタメチレン、3-メチルペンタメチレン、4-メチルペンタメチレン、5-メチルペンタメチレン、1, 1-ジメチルテトラメチレン、2, 2-ジメチルテトラメチレン、3, 3-ジメチルテトラメチレン、4, 4-ジメチルテトラメチレン、ヘプタメチレン、1-メチルヘキサメチレン、2-メチルヘキサメチレン、5-メチルヘキサメチレン、3-エチルペンタメチレン、オクタメチレン、2-メチルヘプタメチレン、5-メチルヘプタメチレン、2-エチルヘキサメチレン、2-エチル-3-メチルペンタメチレン、3-エチル-2-メチルペンタメチレン、ノナメチレン、2-メチルオクタメチレン、7-メチルオクタメチレン、4-エチルヘプタメチレン、3-エチル-2-メチルヘキサメチレン、2-エチル-1-メチルヘキサメチレン、デカメチレン基のような炭素数1乃至10個の直鎖又は分枝鎖アルキレン基であり得、好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキレン基であり、更に好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> アルキレン基であり、より更に好適には、エチレン、トリメチレン又はテトラメチレン基であり、最も好適には、エチレン又はトリメチレン基である。

[ 0 0 2 4 ]

Yの定義における「炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基」の「炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基」部分は、上記「C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>アルキレン基」の鎖端若しくは鎖中に酸素原子若しくは硫黄原子を有する基であり、例えば、式-O-CH<sub>2</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub>-、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>10</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>10</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub>-、-S-CH<sub>2</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub>-、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>10</sub>-

$\text{C}_2$ )<sub>10</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -S -CH<sub>2</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -S -CH<sub>2</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -S -CH<sub>2</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -S -CH<sub>2</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -S - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub> -S -CH<sub>2</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub> -S -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub> -S -又は - (CH<sub>2</sub>)<sub>10</sub> -S -を有する基であり得、好適には、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキレン基であり、更に好適には、式-O - C H<sub>2</sub> -、 -O - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -、 -O - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -、 -CH<sub>2</sub> -O -、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -O -又は - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> -O -を有する基であり、最も好適には、式-CH<sub>2</sub> -O -又は - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> -O -を有する基である。  
10

## 【0025】

R<sup>5</sup> 及び置換基群bの定義における「C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub> シクロアルキル基」、「置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>10</sub> シクロアルキル基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub> - C<sub>10</sub> シクロアルキル基」のC<sub>3</sub> - C<sub>10</sub> シクロアルキル部分は、ベンゼン環のような他の環式基と縮環していてもよく、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、ノルボルニル、アダマンチル又はインダニルであり得、好適には、C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル基であり、最も好適には、シクロヘキシル基である。  
20

## 【0026】

R<sup>5</sup> 及び置換基群bの定義における「硫黄原子、酸素原子又は/及び窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基」、「置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子又は/及び窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子又は/及び窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基複素環基」の硫黄原子、酸素原子又は/及び窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員の芳香族、又は部分若しくは完全還元型の飽和複素環基を示し、例えば、フリル、チエニル、ピロリル、アゼビニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピラニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、テトラヒドロピラニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、オキサゾリジニル、イソキサゾリジニル、チアゾリジニル又はピラゾリジニルであり得、好適には、硫黄原子、酸素原子又は/及び窒素原子を1乃至3個含む5乃至6員芳香族複素環基であり、更に好適には、フリル、チエニル又はピロリルであり、より更に好適には、フリル又はチエニルであり、最も好適には、チエニルである。  
30

## 【0027】

尚、上記「芳香族複素環基」は、他の環式基と縮環していてもよく、それらは、例えば、ベンゾチエニル、イソベンゾフラニル、クロメニル、キサンテニル、フェノキサチニル、インドリジニル、イソインドリル、インドリル、インダゾリル、ブリニル、キノリジニル、イソキノリル、キノリル、フタラジニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、カルバゾリル、カルボリニル、アクリジニル又はイソインドリニルであり得、好適には、ベンゾチエニル基である。  
40

## 【0028】

置換基群aの定義における「ハロゲン原子」は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子であり、好適には、フッ素原子又は塩素原子である。

## 【0029】

$R^4$  及び置換基群 a の定義における「低級アルキル基」は、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、ネオペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルキル基であり得、好適には  $C_1 - C_4$  アルキル基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$  アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

【0030】

10

$R^4$  の定義における「ヒドロキシ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」にヒドロキシ基が置換した基を示し、例えば、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル基のようなヒドロキシ  $C_1 - C_6$  アルキル基であり得、好適には、ヒドロキシ  $C_1 - C_4$  アルキル基であり、更に好適には、ヒドロキシメチル又は2-ヒドロキシエチル基であり、最も好適にはヒドロキシメチル基である。

【0031】

5

置換基群 a の定義における「ハロゲノ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」にハロゲン原子が置換した基を示し、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、フルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-ブロモエチル、2-クロロエチル、2-フルオロエチル、2-ヨードエチル、3-クロロブロピル、4-フルオロブチル、6-ヨードヘキシル、2, 2-ジブロモエチル基のようなハロゲノ  $C_1 - C_6$  アルキル基であり得、好適には、ハロゲノ  $C_1 - C_4$  アルキル基であり、更に好適には、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル又は2, 2, 2-トリクロロエチルであり、最も好適にはトリフルオロメチル基である。

20

【0032】

30

置換基群 a の定義における「低級アルコキシ基」は、前記「低級アルキル基」が酸素原子に結合した基を示し、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブロキシ、イソブロキシ、s-ブロキシ、t-ブロキシ、ペントキシ、イソペントキシ、2-メチルブロキシ、1-エチルブロボキシ、2-エチルブロボキシ、ネオペントキシ、ヘキシルオキシ、4-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3, 3-ジメチルブロキシ、2, 2-ジメチルブロキシ、1, 1-ジメチルブロキシ、1, 2-ジメチルブロキシ、1, 3-ジメチルブロキシ、2, 3-ジメチルブロキシ基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$  アルコキシ基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$  アルコキシ基であり、最も好適には、メトキシ基である。

【0033】

40

置換基群 a の定義における「低級アルキルチオ基」は、前記「低級アルキル基」が硫黄原子に結合した基を示し、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、ペンチルチオ、イソペンチルチオ、2-メチルブチルチオ、ネオペンチルチオ、ヘキシルチオ、4-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ、2, 2-ジメチルブチルチオ、1, 1-ジメチルブチルチオ、1, 2-ジメチルブチルチオ、1, 3-ジメチルブチルチオ、2, 3-ジメチルブチルチオ基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルキルチオ基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$  アルキルチオ基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$  アルキルチオ基であり、最も好適には、メチルチオ基である。

【0034】

$R^1$ 、 $R^2$  及び置換基群 a の定義における「低級アルコキシカルボニル基」は、前記「低

50

級アルコキシ基」がカルボニル基に結合した基を示し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、ペントキシカルボニル、イソペントキシカルボニル、2-メチルブトキシカルボニル、ネオペントキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、4-メチルペントキシカルボニル、3, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 1-ジメチルブトキシカルボニル、1, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 3-ジメチルブトキシカルボニル基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルコキシカルボニル基であり得、好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシカルボニル基であり、更に好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルコキシカルボニル基であり、最も好適には、メトキシカルボニル基である。

10

## 【0035】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> 及び置換基群aの定義における「低級脂肪族アシル基」は、水素原子又は飽和若しくは不飽和の鎖状炭化水素基がカルボニル基に結合した基を示し、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、アクリロイル、メタクリロイル、クロトノイル基のような炭素数1乃至8個の直鎖又は分枝鎖低級脂肪族アシル基であり得、好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 低級脂肪族アシル基であり、更に好適には、アセチル又はプロピオニル基であり、最も好適には、アセチル基である。

20

## 【0036】

置換基群aの定義における「モノー低級アルキルアミノ基」は、前記「低級アルキル基」が1個アミノ基に結合した基を示し、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、ネオペンチルアミノ、1-エチルプロピルアミノ、ヘキシルアミノ、イソヘキシルアミノ、4-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、3, 3-ジメチルブチルアミノ、2, 2-ジメチルブチルアミノ、1, 1-ジメチルブチルアミノ、1, 2-ジメチルブチルアミノ、1, 3-ジメチルブチルアミノ、2, 3-ジメチルブチルアミノ、2-エチルブチルアミノ基のようなモノーC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルアミノ基であり得、好適には、モノーC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルアミノ基であり、更に好適には、モノーC<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルアミノ基であり、最も好適には、メチルアミノ基である。

30

## 【0037】

置換基群aの定義における「ジー低級アルキルアミノ基」は、前記「低級アルキル基」が2個アミノ基に結合した基を示し、例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ基のようなジーC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルアミノ基であり得、好適には、ジーC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルアミノ基であり、更に好適には、ジーC<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキルアミノ基であり、最も好適には、ジメチルアミノ基である。

40

## 【0038】

上記式中、置換基群aの定義における「低級脂肪族アシルアミノ基」は、前記「低級脂肪族アシル基」がアミノ基に結合した基を示し、例えば、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、バレリルアミノ、イソバレリルアミノ、ピバロイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、アクリロイルアミノ、メタクリロイルアミノ、クロトノイルアミノ基のような炭素数1乃至7個の直鎖又は分枝鎖低級脂肪族アシルアミノ基であり得、好適には、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 脂肪族アシルアミノ基であり、更に好適には、アセチルアミノ又はプロピオニルアミノ基であり、最も好適には、アセチルアミノ基である。

## 【0039】

50

$R^3$  及び  $R_a^3$  の定義における「リン酸基の保護基」は、例えば、メチル、エチル、イソプロピル、ブチルのような低級アルキル基、2-シアノエチル、2-シアノ-1, 1-ジメチルエチルのようなシアノ基で置換された低級アルキル基、2-(メチルジフェニルシリル)エチル、2-トリメチルシリルエチルのような低級アルキル又は低級アルキルとアリールとでトリ置換されたシリル基で置換された低級アルキル基、2-(2'-ピリジル)エチル、2-(4'-ピリジル)エチルのようなヘテロシクリルで置換された低級アルキル基、

2-フェニルチオエチル、2-(4'-ニトロフェニルチオ)エチル、2-(4'-トリ

10

フェニルメチルフェニルチオ)エチルのようなアリールチオで置換された低級アルキル基 2-(t-ブチルスルホニル)エチル、2-(フェニルスルホニル)エチル、2-(ベンジルスルホニル)エチルのようなアルキルスルホニル、アリールスルホニル又はアリールアルキルスルホニルで置換された低級アルキル基、

2, 2, 2-トリクロロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル-1, 1-ジメチルエチル、2, 2, 2-トリプロモエチル、2, 3-ジプロモプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチルのようなハロゲノ低級アルキル基；

ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、 $\alpha$ -ナフチルメチル、 $\beta$ -ナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、9-アンスリルメチルのような1~3個のアリール基で置換された低級アルキル基、o-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、2, 4-ジニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-クロロ-2-ニトロベンジル、4-アシルオキシベンジルのようなニトロ、ハロまたは低級脂肪族アシルでアリール環が置換されたアリール基で置換された低級アルキル基、2-ニトロフェニルエチルのような置換基を有するアリール基で置換された低級アルキル基、9-フルオレニルメチルのようなフルオレニル基で置換された低級アルキル基などのアラルキル類；

20

アリル、プロペニルのような低級アルケニル基、

4-シアノ-2-ブテニルのようなシアノで置換された低級アルケニル基；

フェニルのようなアリール基、

2-メチルフェニル、2, 6-ジメチルフェニル、2-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2-プロモフェニル、4-ニトロフェニル、3, 5-ジニトロフェニル、4-クロロ-2-ニトロフェニル、2-メトキシ-5-ニトロフェニルのような低級アルキル、アリール基でトリ置換された低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ又はハロで置換されたアリール基；

30

並びに

アニリデイト、4-トリフェニルメチルアニリデイト、[N-(2-トリチロキシ)エチル]アニリデイト、p-(N, N-ジメチルアミノ)アニリデイト、3-(N, N-ジエチルアミノメチル)アニリデイトのようなアミド類

である。

40

#### 【0040】

「リン酸基の保護基」は、好適には、低級アルキル基、低級アルケニル基または1~3個のフェニル若しくはナフチルで置換されたメチル基であり、更に好適には、メチル基、エチル基、アリール基またはベンジル基であり、最も好適には、メチル基又はエチル基である。

#### 【0041】

$R^5$  の定義における「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル基」の具体例としては、例えば、2-フルオロシクロプロピル、2-クロロシクロプロピル、2-若しくは3-フルオロシクロベンチル、2-若しくは3-クロロシクロベンチル、2-, 3-若しくは4-フルオロシクロヘキシル、2-, 3-若

50

しくは 4-クロロシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-プロモシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-ヨードシクロヘキシル、2-メチルシクロプロピル、2-エチルシクロプロピル、2-若しくは 3-メチルシクロベンチル、2-若しくは 3-エチルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-メチルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-エチルシクロヘキシル、2-トリフルオロメチルシクロプロピル、2-若しくは 3-トリフルオロメチルシクロブチル、2-若しくは 3-トリフルオロメチルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、2-メトキシシクロプロピル、2-若しくは 3-メトキシシクロブチル、2-若しくは 3-メトキシシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-メトキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-エトキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-プロポキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-イソプロポキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-(1-エチルプロポキシ)シクロヘキシル、2-, 3-若しくは 4-(2-エチルプロポキシ)シクロヘキシル、2-カルボキシシクロプロピル、2-若しくは 3-カルボキシシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-カルボキシシクロヘキシル、2-メトキカルボニルシクロプロピル、2-若しくは 3-メトキカルボニルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-メトキカルボニルシクロヘキシル、2-ヒドロキシシクロプロピル、2-若しくは 3-ヒドロキシシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-ヒドロキシシクロヘキシル、2-ホルミルシクロプロピル、2-若しくは 3-ホルミルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-ホルミルシクロヘキシル、2-アセチルシクロプロピル、2-若しくは 3-アセチルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-アミノシクロヘキシル、2-メチルアミノシクロプロピル、2-若しくは 3-メチルアミノシクロブチル、2-若しくは 3-メチルアミノシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-メチルアミノシクロヘキシル、2-ジメチルアミノシクロプロピル、2-若しくは 3-ジメチルアミノシクロブチル、2-若しくは 3-ジメチルアミノシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-ジメチルアミノシクロヘキシル、2-シアノシクロプロピル、2-若しくは 3-シアノシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-シアノシクロヘキシル、2-若しくは 3-シクロヘキシルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-シクロヘキシルシクロヘキシル、2-フェニルシクロプロピル、2-若しくは 3-フェニルシクロベンチル、2-, 3-若しくは 4-フェニルシクロヘキシル、3, 4-ジフルオロシクロヘキシル、3, 4-ジクロロシクロヘキシル、2, 3-ジメトキシシクロヘキシル、3, 4-ジメトキシシクロヘキシル、3, 5-ジメトキシシクロヘキシル、3, 4, 5-トリメトキシシクロヘキシル基であり得、好適には、1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、更に好適には、1乃至3個置換されたC<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、より更に好適には、1個置換されたシクロヘキシル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、最も好適には、1個置換されたシクロヘキシル基（該置換基は、フッ素原子、塩素原子、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ及びアセチル基から成る群から選択される基である。）である。

## 【0042】

R<sup>5</sup>の定義における「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基」の具体例は、例えば、2-, 3-若しくは 4-フルオロフェニル、2-, 3-若しくは 4-クロロフェニル、2-, 3-若しくは 4-プロモフェニル、2-, 3-若しくは 4-ヨードフェニル、2-, 3-若しくは 4-メチルフェニル、2-, 3-若しくは 4-エチルフェニル、2-, 3-若しくは 4-プロピルフェニル、2-, 3-若しくは 4-ブチルフェニル、2-, 3-若しくは 4-ペンチルフェニル、2-, 3-若し 50

くは4-トリフルオロメチルフェニル、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル、2-, 3-若しくは4-エトキシフェニル、2-, 3-若しくは4-プロポキシフェニル、2-, 3-若しくは4-イソプロポキシフェニル、2-, 3-若しくは4-ブトキシフェニル、2-, 3-若しくは4-(1-エチルプロポキシ)フェニル、2-, 3-若しくは4-(2-エチルプロポキシ)フェニル、2-, 3-若しくは4-メチルチオフェニル、2-, 3-若しくは4-エチルチオフェニル、2-, 3-若しくは4-カルボキシフェニル、2-, 3-若しくは4-メトキカルボニルフェニル、2-, 3-若しくは4-エトキシカルボニルフェニル、2-, 3-若しくは4-ヒドロキシフェニル、2-, 3-若しくは4-ホルミルフェニル、2-, 3-若しくは4-アセチルフェニル、2-, 3-若しくは4-アミノフェニル、2-, 3-若しくは4-メチルアミノフェニル、2-, 3-若しくは4-ジメチルアミノフェニル、2-, 3-若しくは4-シアノフェニル、2-, 3-若しくは4-シクロペンチルフェニル、2-, 3-若しくは4-シクロヘキシルフェニル、2-, 3-若しくは4-ビフェニル、2-, 4-ジフルオロフェニル、3-, 4-ジフルオロフェニル、3-, 5-ジフルオロフェニル、2-, 4-ジクロロフェニル、3-, 4-ジクロロフェニル、3-, 5-ジクロロフェニル、3-, 4-ジプロモフェニル、2-, 3-ジメチルフェニル、3-, 4-ジメチルフェニル、3-, 5-ジメチルフェニル、2-, 3-ジメトキシフェニル、3-, 4-ジメトキシフェニル、3-, 5-ジメトキシフェニル、3-, 4-, 5-トトリメトキシフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、4-メチル-2-メトキシフェニル、6-フルオロ-4-メチル-2-メトキシフェニル、5-フルオロインデン-3-イル、5-フルオロインデン-3-イル、5-メチルインデン-3-イル、5-メトキシインデン-3-イル、5-フルオロインデン-2-イル、5-クロロインデン-2-イル、5-メチルインデン-2-イル、5-メトキシインデン-2-イル、5-ヒドロキシインデン-3-イル、5-ニトロインデン-3-イル、5-シクロヘキシルインデン-3-イル、5-フェニルインデン-3-イル、5-フェノキシインデン-3-イル、5-ベンジルオキシインデン-3-イル、5-フェニルチオインデン-3-イル、5-ヒドロキシインデン-2-イル、5-ニトロインデン-2-イル、5-シクロヘキシルインデン-2-イル、5-フェニルインデン-2-イル、5-フルオロナフタレン-2-イル、5-メチルナフタレン-2-イル、5-メトキシナフタレン-2-イル、5-フルオロナフタレン-1-イル、5-フルオロナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、5-メトキシナフタレン-1-イル、5-ヒドロキシナフタレン-2-イル、5-ニトロナフタレン-2-イル、5-シクロヘキシルナフタレン-2-イル、5-フェニルナフタレン-2-イル、5-フェノキシナフタレン-2-イル、5-ベンジルオキシナフタレン-2-イル、5-フェニルチオナフタレン-2-イル、5-ヒドロキシナフタレン-1-イル、5-ニトロナフタレン-1-イル、5-シクロヘキシルナフタレン-1-イル、5-フェニルナフタレン-1-イル基であり、好適には、1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基(該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。)であり、更に好適には、1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基(該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。)であり、より更に好適には、1乃至3個置換されたフェニル基(該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。)であり、更により好適には、1乃至2個置換されたフェニル基(該置換基は、フッ素原子、塩素原子、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ及びアセチル基から成る群から選択される基である。但し、メトキシ基については、1乃至3個置換されたフェニル基が好ましい。)であり、最も好適には、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3-, 4-ジフルオロフェニル、3-, 5-ジフルオロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3-, 4-ジクロロフェニル、3-, 5-ジクロロフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、3-, 4-ジメチルフェニル、3-, 5-ジメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル

10

20

30

40

50

、4-トリフルオロメチルフェニル、3,4-ジトリフルオロメチルフェニル、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、3-アセチルフェニル又は4-アセチルフェニル基である。

## 【0043】

R<sup>5</sup>の定義における「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基」の具体例は、例えば、3-,4-若しくは5-メチルフラン-2-イル、2-,4-若しくは5-メチルフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-フルオロチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-フルオロフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-プロモチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-プロモフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-メチルチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-メチルチオフェン-3-イル、3-,4-若しくは5-エチルチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-エチルチオフェン-3-イル、3-,4-若しくは5-メトキシチオフェン-3-イル、3-若しくは4-メチルチアゾール-5-イル、3-,4-若しくは5-フルオロベンゾチオフェン-2-イル、3-,4-若しくは5-メチルベンゾチオフェン-2-イル、3-,4-若しくは5-メトキシベンゾチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-フルオロベンゾチオフェン-3-イル、2-,4-若しくは5-プロモベンゾチオフェン-3-イル、2-,4-若しくは5-メチルベンゾチオフェン-3-イル、2-,4-若しくは5-メトキシベンゾチオフェン-3-イル、4-,5-,6-若しくは7-メチルベンゾチオフェン-2-イル、3-,4-若しくは5-ヒドロキシフラン-2-イル、2-,4-若しくは5-ヒドロキシフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-ヒドロキシチオフェン-2-イル、3-,4-若しくは5-フェニルチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-シアノチオフェン-3-イル、1-,2-若しくは3-ヒドロキシピリジン-4-イル、1-,2-若しくは3-シアノピリジン-4-イル、1-,2-若しくは3-フェニルピリジン-4-イル基であり、好適には、3-,4-若しくは5-フルオロチオフェン-2-イル又は2-,4-若しくは5-フルオロフラン-3-イル基である。

10

20

30

40

## 【0044】

「その薬理上許容される塩」とは、本発明の一般式(I)を有する化合物は、アミノ基のような塩基性の基を有する場合には酸と反応させることにより、又、リン酸基のような酸性基を有する場合には塩基と反応させることにより、塩にすることができるので、その塩を示す。

## 【0045】

塩基性の基に基づく塩は、例えば、フッ化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩、硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルカンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなアリールスルホン酸塩、酢酸塩、リンゴ酸塩、フマール酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩等の有機酸塩；又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり得、好適には、有機酸塩（特に、フマール酸塩、シュウ酸塩若しくはマレイン酸塩）又はハロゲン化水素酸塩（特に、塩酸塩）である。

## 【0046】

一方、酸性の基に基づく塩は、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、リチウム塩のようなアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩、アルミニウム塩、鉄塩等の金属塩；アンモニウム塩のような無機塩、t-オクチルアミン塩、ジベンジルアミン塩、モルホリン塩、グルコサミン塩、フェニルグリシンアルキルエステル塩

50

、エチレンジアミン塩、N-メチルグルカミン塩、グアニジン塩、ジエチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、N, N'-ジベンジルエチレンジアミン塩、クロロプロカイン塩、プロカイン塩、ジエタノールアミン塩、N-ベンジルフェネチルアミン塩、ピペラジン塩、テトラメチルアンモニウム塩、トリス(ヒドロキシメチル)アミノメタン塩のような有機塩等のアミン塩；又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり得、好適には、アルカリ金属塩(特に、ナトリウム塩)である。

## 【0047】

本発明の一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、大気中に放置したり、又は、再結晶をすることにより、水分を吸収し、吸着水が付いたり、水和物となる場合があり、そのような水和物も本発明の塩に包含される。

10

## 【0048】

本発明の一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、その分子内に不斉炭素原子を有するので、光学異性体が存在する。本発明の化合物においては、光学異性体および光学異性体の混合物がすべて単一の式、即ち一般式(I)で示されている。従って、本発明は光学異性体および光学異性体の任意の割合の混合物をもすべて含むものである。

## 【0049】

本発明の一般式(I)を有する化合物は、好適には、式-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>を有する基が結合している不斉炭素原子に関して、Rの絶対配位を有する化合物である。

20

## 【0050】

上記における「エステル」とは、前述の一般式(I)を有する化合物は、エステルにすることができるので、そのエステルをいい、そのようなエステルとしては、「ヒドロキシ基のエステル」及び「カルボキシル基のエステル」を挙げることができ、各々のエステル残基が「反応における一般的保護基」又は「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」であるエステルをいう。

## 【0051】

「反応における一般的保護基」とは、加水分解、加水分解、電気分解、光分解のような化学的方法により開裂し得る保護基をいう。

30

## 【0052】

「ヒドロキシ基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」は、例えば、前記「低級脂肪族アシル基」、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチルのようなハロゲノ低級脂肪族アシル基、メトキシアセチルのような低級アルコキシで置換された低級脂肪族アシル基などの「脂肪族アシル類」；ベンゾイル、1-インダンカルボニル、2-インダンカルボニル、1-若しくは2-ナフトイルのような芳香族アシル基、4-クロロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2,4,6-トリメチルベンゾイル、4-トルオイル、4-アニソイル4-ニトロベンゾイル、2-ニトロベンゾイル、2-(メトキシカルボニル)ベンゾイル、4-フェニルベンゾイルのような前記置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基などの「芳香族アシル類」；

40

テトラヒドロピラン-2-イル、3-プロモテトラヒドロピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロピラン-4-イル、テトラヒドロチオピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロチオピラン-4-イルのような「テトラヒドロピラニル又はテトラヒドロチオピラニル類」；

テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロチオフラン-2-イルのような「テトラヒドロフラニル又はテトラヒドロチオフラニル類」；

トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジメチルシリル、t-ブチルジメチルシリル、メチルジイソプロピルシリル、メチルジー-t-ブチルシリル、トリイソプロピルシリルのようなトリ低級アルキルシリル基、ジフェニルメチルシリル、ジフェニルブチ

50

ルシリル、ジフェニルイソプロピルシリル、フェニルジイソプロピルシリルのようなアリールまたはアリールと低級アルキルとでトリ置換されたシリル基などの「シリル類」；メトキシメチル、1, 1-ジメチル-1-メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、ブトキシメチル、*t*-ブトキシメチルのような低級アルコキシメチル基、2-メトキシエトキシメチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシメチル基、2, 2, 2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲノ低級アルコキシメチル等の「アルコキシメチル基」；

1-エトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチルのような低級アルコキシ化エチル基、2, 2, 2-トリクロロエチルのようなハロゲン化エチル基等の「置換エチル類」；

10

ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、 $\alpha$ -ナフチルメチル、 $\beta$ -ナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、9-アンスリルメチルのような1乃至3個のアリール基で置換された低級アルキル基、4-メチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、3, 4, 5-トリメチルベンジル、4-メトキシベンジル、4-メトキシフェニルジフェニルメチル、2-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-プロモベンジル、4-シアノベンジル、4-シアノベンジルジフェニルメチル、ビス(2-ニトロフェニル)メチル、ピペロニルのような低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ハロまたはシアノでアリール環が置換された1~3個のアリール基で置換された低級アルキル基などの「アラルキル類」；

前記「低級アルコキシカルボニル基」、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、2-トリメチルシリルエトキシカルボニルのようなハロゲンまたはトリ低級アルキルシリルで置換された低級アルコキシカルボニル基などの「アルコキシカルボニル類」；

20

ビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニルのような「アルケニルオキシカルボニル類」；又は

ベンジルオキシカルボニルのようなアラルキルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル、3, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル、2-ニトロベンジルオキシカルボニル、4-ニトロベンジルオキシカルボニルのような前記置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基などの「アラルキルオキシカルボニル類」である。

## 【0053】

30

一方、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」とは、人体内で加水分解等の生物学的方法により開裂し、フリーの酸又はその塩を生成する保護基をいい、そのような誘導体か否かは、ラットやマウスのような実験動物に静脈注射により投与し、その後の動物の体液を調べ、元となる化合物又はその薬理学的に許容される塩を検出できることにより決定できる。「ヒドロキシ基のエステル」に斯かる、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」は、例えば、

エチルカルボニルオキシメチル、ピバロイルオキシメチル、ジメチルアミノアセチルキシメチル、1-アセトキシエチルのようなアシルオキシアルキル類；

1-(メトキシカルボニルオキシ)エチル、1-(エトキシカルボニルオキシ)エチル、エトキシカルボニルオキシメチル、1-(イソプロポキシカルボニルオキシ)エチル、1-(*t*-ブトキシカルボニルオキシ)エチル、1-(エトキシカルボニルオキシ)プロピル、1-(シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ)エチルのような1-(アルコキシカルボニルオキシ)アルキル類；

40

フタリジル基；

4-メチル-オキソジオキソレニルメチル、4-フェニル-オキソジオキソレニルメチル、オキソジオキソレニルメチルのようなオキソジオキソレニルメチル基等の「カルボニルオキシアルキル類」；

前記「脂肪族アシル類」；

前記「芳香族アシル類」；

「コハク酸のハーフエステル塩残基」；

50

「リン酸エステル塩残基」；

「アミノ酸等のエステル形成残基」；

カルバモイル基；

ベンジリデンのようなアラルキリデン基；メトキシエチリデン、エトキシエチリデンのようなアルコキシエチリデン基；オキソメチレン；チオキソメチレンのような「2つのヒドロキシ基の保護基」；又は

ビバロイルオキシメチルオキシカルボニルのような「カルボニルオキシアルキルオキシカルボニル基」であり、好適には、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基である。

【0054】

10

上記「ヒドロキシ基の保護基」として、特に好適には、脂肪族アシル基又は芳香族アシル基である。

【0055】

20

「カルボキシル基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」は、好適には、前記「低級アルキル基」；エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-エチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、1-メチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-2-プロピニル、2-エチル-2-プロピニル、2-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-2-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-ペンチニル、1-メチル-2-ペンチニル、2-メチル-2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニルのような低級アルキニル基；エチニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-2-プロピニル、2-エチル-2-プロピニル、2-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-2-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-ペンチニル、1-メチル-2-ペンチニル、2-メチル-2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニルのような低級アルキニル基；前記「ハロゲノ低級アルキル」；2-ヒドロキシエチル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、3-ヒドロキシプロピル、3, 4-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシプロピルのようなヒドロキシ「低級アルキル基」；アセチルメチルのような「低級脂肪族アシル」－「低級アルキル基」；前記「アラルキル基」；又は前記「シリル基」である。

30

【0056】

40

「カルボキシル基のエステル」に斯かる「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」は、好適には、メトキシエチル、1-エトキシエチル、1-メチル-1-メトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、1, 1-ジメチル-1-メトキシエチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、n-ブトキシメチル、t-ブトキシメチルのような低級アルコキシ低級アルキル基、2-メトキシエトキシメチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシ低級アルキル基、フェノキシメチルのような「アリール」オキシ「低級アルキル基」、2, 2, 2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲン化低級アルコキシ低級アルキル基等の「アルコキシアルキル基」；メトキシカルボニルメチルのような「「低級アルコキシ」カルボニル「低級アルキル基」」；シアノメチル、2-シアノエチルのような「シアノ「低級アルキル基」」；メチルチオメチル、エチルチオメチルのような「「低級アルキル」チオメチル基」；フェニルチオメチル、ナフチルチオメチルのような「「アリール」チオメチル基」；2-メタンスルホニルエチル、2-トリフルオロメタンスルホニルエチルのような「ハロゲンで置換されていてもよ

50

い「低級アルキル」スルホニル「低級アルキル基」」；2-ベンゼンスルホニルエチル、2-トルエンスルホニルエチルのような「アリール」スルホニル「低級アルキル基」」；前記「1-(アシルオキシ)「低級アルキル基」」；前記「フタリジル基」；前記「アリール基」；前記「低級アルキル基」；カルボキシメチルのような「カルボキシアルキル基」；又はフェニルアラニンのような「アミノ酸のアミド形成残基」である。

## 【0057】

上記「カルボキシ基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」及び「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」において、更に好適には、低級アルキル又はアラルキル基である。

## 【0058】

本発明の一般式(I)を有する化合物の具体例としては、例えば、下記表1及び表2に記載の化合物を挙げることができるが、本発明は、これらの化合物に限定されるものではない。なお、同一の化合物番号で表される化合物は、ZがO又は-CH<sub>2</sub>-の2つの化合物を示す。

## 【0059】

表中の略号は以下の通りである。

B u	:	ブチル基
i B u	:	イソブチル基
B z	:	ベンジル基
E t	:	エチル基
c H x	:	シクロヘキシル基
M e	:	メチル基
N p (1)	:	ナフタレン-1-イル基
N p (2)	:	ナフタレン-2-イル基
P h	:	フェニル基
c P n	:	シクロペンチル基
P r	:	プロピル基
i P r	:	イソプロピル基。

10

20

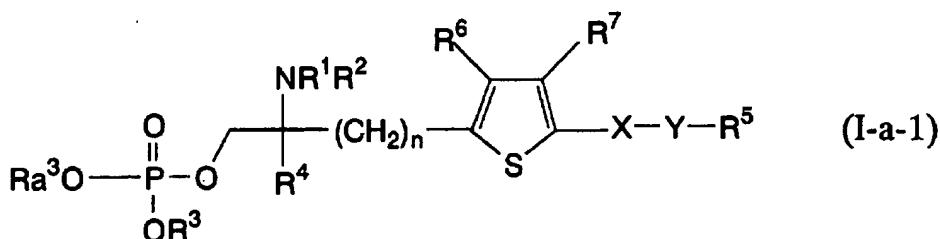
## 【0060】

表1

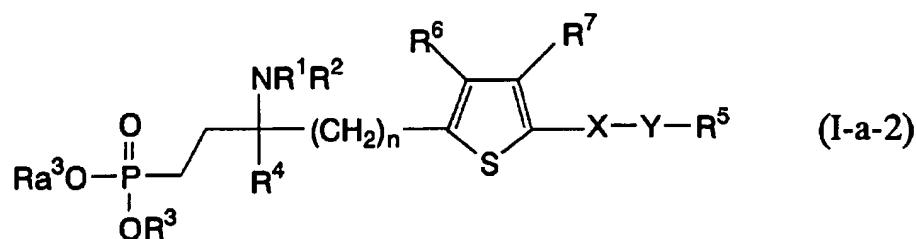
30

## 【0061】

## 【化7】



又は



40

## 【0062】

50

【表1】

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sub>a</sub> <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-X-Y-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
1-1	H	H	H	H	Me	1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2	H	H	H	H	Me	1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-3	H	H	H	H	Me	1	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-4	H	H	H	H	Me	1	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-5	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-6	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-7	H	H	H	H	Me	1	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-8	H	H	H	H	Me	1	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-9	H	H	H	H	Me	1	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-10	H	H	H	H	Me	1	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-11	H	H	H	H	Me	1	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-12	H	H	H	H	Me	1	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-13	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cPn	H	H
1-14	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cPn	H	H
1-15	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-16	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-17	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-18	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-19	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-20	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-21	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-22	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-23	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-24	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-25	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-26	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H

10

20

30

40

1-27	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-CHx)	H	H
1-28	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-CHx)	H	H
1-29	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-CHx)	H	H
1-30	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CHx-CHx)	H	H
1-31	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-CHx)	H	H
1-32	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-33	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-34	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-35	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-36	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-37	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-38	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-39	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-40	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-41	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-42	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-43	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CHx-Ph)	H	H
1-44	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-45	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CHx	H	H
1-46	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CHx	H	H
1-47	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CHx	H	H
1-48	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CHx	H	H
1-49	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-CHx)	H	H
1-50	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-CHx)	H	H
1-51	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-CHx)	H	H
1-52	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -CHx)	H	H
1-53	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-CHx)	H	H
1-54	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-CHx)	H	H
1-55	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-CHx)	H	H

10

20

30

40

1-56	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-57	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-58	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-59	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-60	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-61	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-62	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-63	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-64	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-65	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-66	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-67	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-68	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-69	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-70	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-71	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-72	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-73	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-74	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-75	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-76	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-77	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-78	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-79	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-80	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-81	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-82	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-83	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-84	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

1-85	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-86	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-87	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-88	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-89	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-90	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-91	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-92	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-93	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-94	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-95	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-96	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-97	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPn	H	H
1-98	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-99	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	Me	H
1-100	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	Me
1-101	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	F	H
1-102	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	F
1-103	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-104	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-105	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-106	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-F-cHx)	H	H
1-107	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-108	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-109	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-110	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-111	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-112	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-113	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-114	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-115	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-116	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-117	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-118	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-119	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-120	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-121	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-122	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-123	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-124	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-125	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-126	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-127	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-128	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-129	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-130	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-131	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-132	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-133	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-134	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-135	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-136	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-137	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-138	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-139	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-140	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-141	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-142	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H

10

30

40

1-143	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iBuS-CHx)	H	H
1-144	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iBuS-CHx)	H	H
1-145	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-CHx-CHx)	H	H
1-146	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CHx-CHx)	H	H
1-147	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Ph-CHx)	H	H
1-148	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-CHx)	H	H
1-149	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-CHx)	H	H
1-150	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-CHx)	H	H
1-151	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-CHx)	H	H
1-152	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-153	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	Me	H
1-154	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	Me
1-155	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	F	H
1-156	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	F
1-157	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-158	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-159	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-160	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-161	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-162	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-163	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-164	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-165	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-166	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-167	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-168	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H
1-169	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-170	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H
1-171	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H

10

30

40

1-172	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-173	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H	
1-174	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-175	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-176	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	
1-177	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-178	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H	
1-179	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	
1-180	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H	
1-181	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H	
1-182	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H	
1-183	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H	
1-184	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	
1-185	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	
1-186	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H	
1-187	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H	
1-188	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H	
1-189	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-190	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H	
1-191	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H	
1-192	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H	
1-193	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H	
1-194	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H	
1-195	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H	
1-196	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-197	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-198	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-199	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-200	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H	

10

20

30

40

1-201	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-202	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H
1-203	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-204	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2, 4-diMe-Ph)	H	H
1-205	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3, 4-diMe-Ph)	H	H
1-206	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3, 5-diMe-Ph)	H	H
1-207	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Np(1)	H	H
1-208	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Np(2)	H	H
1-209	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cPn	H	H
1-210	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-211	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	Me	H
1-212	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	Me
1-213	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	F	H
1-214	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	F
1-215	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-216	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-217	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-218	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-F-cHx)	H	H
1-219	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-220	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-221	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-222	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-223	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-224	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-225	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-226	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-227	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-228	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-229	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H

10

30

40

1-230	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-231	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-232	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-233	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-234	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-235	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-236	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-237	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-238	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-239	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-240	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-241	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-242	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-243	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-244	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-245	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-246	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-247	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-248	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-249	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-250	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-251	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-252	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-253	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-254	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-255	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H
1-256	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H
1-257	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H
1-258	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-259	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H	
1-260	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	
1-261	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H	
1-262	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H	
1-263	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H	
1-264	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	
1-265	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	Me	H	10
1-266	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	Me	
1-267	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	F	H	
1-268	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	F	
1-269	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	
1-270	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	
1-271	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	
1-272	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-F-Ph)	H	H	20
1-273	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-Ph)	H	H	
1-274	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	
1-275	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-Ph)	H	H	
1-276	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	
1-277	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	
1-278	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Et-Ph)	H	H	
1-279	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	30
1-280	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H	
1-281	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H	
1-282	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H	
1-283	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H	
1-284	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H	
1-285	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H	
1-286	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	40
1-287	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	

1-288	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-289	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-290	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-291	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-292	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-293	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-294	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-295	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-296	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-297	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-298	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-299	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-300	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-301	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-302	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H
1-303	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H
1-304	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H
1-305	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H
1-306	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H
1-307	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H
1-308	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-309	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-310	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H
1-311	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H
1-312	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H
1-313	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-314	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H
1-315	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-316	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-317	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-318	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-319	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Np(1)	H	H
1-320	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Np(2)	H	H
1-321	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-322	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-323	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-324	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-325	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-326	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-327	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-328	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-329	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-330	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-331	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-332	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-333	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-334	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-335	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-336	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-337	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-338	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-339	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-340	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-341	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-342	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-343	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-344	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-345	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H

1-346	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-347	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -cHx	H	H
1-348	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -cHx	H	H
1-349	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -cHx	H	H
1-350	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -cHx	H	H
1-351	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-352	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-353	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-354	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-355	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-356	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-357	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-358	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-359	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-360	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H
1-361	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H
1-362	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H
1-363	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H
1-364	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-365	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-366	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-367	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-368	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-369	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-370	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-371	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-372	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-373	H	H	H	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H
1-374	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H

10

30

40

1-375	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-cHx	H	H
1-376	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-cHx	H	H
1-377	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-F-cHx)	H	H
1-378	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Me-cHx)	H	H
1-379	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Et-cHx)	H	H
1-380	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-381	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-MeO-cHx)	H	H
1-382	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-EtO-cHx)	H	H
1-383	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-MeS-cHx)	H	H
1-384	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-cHx-cHx)	H	H
1-385	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Ph-cHx)	H	H
1-386	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-Ph	H	H
1-387	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-Ph	H	H
1-388	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-Ph	H	H
1-389	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-Ph	H	H
1-390	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-F-Ph)	H	H
1-391	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Me-Ph)	H	H
1-392	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Et-Ph)	H	H
1-393	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-394	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-MeO-Ph)	H	H
1-395	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-EtO-Ph)	H	H
1-396	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-MeS-Ph)	H	H
1-397	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-cHx-Ph)	H	H
1-398	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Ph-Ph)	H	H
1-399	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cPn	H	H
1-400	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	H
1-401	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	Me	H
1-402	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	Me
1-403	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	F	H

1-404	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	F
1-405	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	H
1-406	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	H
1-407	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-cHx	H	H
1-408	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-F-cHx)	H	H
1-409	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-F-cHx)	H	H
1-410	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Cl-cHx)	H	H
1-411	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Br-cHx)	H	H
1-412	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-Me-cHx)	H	H
1-413	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Me-cHx)	H	H
1-414	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-Et-cHx)	H	H
1-415	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Et-cHx)	H	H
1-416	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-Pr-cHx)	H	H
1-417	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Pr-cHx)	H	H
1-418	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-iPr-cHx)	H	H
1-419	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-Bu-cHx)	H	H
1-420	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-Bu-cHx)	H	H
1-421	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-422	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-423	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-MeO-cHx)	H	H
1-424	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-MeO-cHx)	H	H
1-425	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-EtO-cHx)	H	H
1-426	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-EtO-cHx)	H	H
1-427	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-PrO-cHx)	H	H
1-428	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-PrO-cHx)	H	H
1-429	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-430	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-431	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-432	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -0-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H

10

30

40

1-433	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-434	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-435	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-436	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-437	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-EtS-cHx)	H	H
1-438	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-EtS-cHx)	H	H
1-439	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-PrS-cHx)	H	H
1-440	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-PrS-cHx)	H	H
1-441	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-442	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-443	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-444	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-445	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-446	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-447	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-cHx-cHx)	H	H
1-448	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-449	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Ph-cHx)	H	H
1-450	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-451	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-452	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-453	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-454	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H
1-455	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	Me	H
1-456	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	Me
1-457	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	F	H
1-458	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	F
1-459	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H
1-460	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H	
1-461	CO <sub>2</sub> Et	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H	

10

20

30

40

1-462	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H
1-463	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H
1-464	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-465	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Br-Ph)	H	H
1-466	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H
1-467	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H
1-468	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Et-Ph)	H	H
1-469	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H
1-470	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-471	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-472	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-473	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-474	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-475	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-476	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-477	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-478	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-479	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-480	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-481	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-482	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-483	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-484	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-485	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-486	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-487	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-488	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-489	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-490	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-MeS-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-491	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-492	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-EtS-Ph)	H	H
1-493	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-EtS-Ph)	H	H
1-494	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-PrS-Ph)	H	H
1-495	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-PrS-Ph)	H	H
1-496	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-497	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-498	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-499	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-500	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-501	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-502	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-cHx-Ph)	H	H
1-503	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-504	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3-Ph-Ph)	H	H
1-505	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-506	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(2, 4-diMe-Ph)	H	H
1-507	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3, 4-diMe-Ph)	H	H
1-508	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-(3, 5-diMe-Ph)	H	H
1-509	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-cHx	H	H
1-510	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-Ph	H	H
1-511	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -O-cHx	H	H
1-512	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -O-Ph	H	H
1-513	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-514	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-515	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-516	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-517	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-518	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-519	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H

10

30

40

1-520	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-521	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-522	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-523	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-524	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-525	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-526	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-527	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-528	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-529	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-530	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-531	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-532	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-533	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-534	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-535	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-536	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-537	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-538	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-539	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cPn	H	H
1-540	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-541	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	Me	H
1-542	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	Me
1-543	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	F	H
1-544	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	F
1-545	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-546	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-547	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-548	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-cHx)	H	H

1-549	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-550	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-551	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-552	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-553	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-554	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-555	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-556	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-557	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-558	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-559	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-560	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-561	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-562	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-563	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-564	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-565	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-566	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-567	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-568	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-569	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-570	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-571	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-572	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-573	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-574	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-575	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-576	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-577	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-578	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-579	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-580	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-581	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-582	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-583	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-584	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-585	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H
1-586	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H
1-587	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H
1-588	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-589	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H
1-590	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-591	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-592	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-593	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-594	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-595	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	Me	H
1-596	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	Me
1-597	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	F	H
1-598	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	F
1-599	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-600	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-601	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-602	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-603	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-604	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-605	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-606	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-Ph)	H	H

10

30

40

1-607	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-608	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-609	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-610	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H
1-611	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-612	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H
1-613	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-614	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-615	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-616	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-617	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-618	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-619	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-620	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-621	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-622	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-623	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-624	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-625	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-626	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-627	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-628	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-629	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-630	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-631	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-632	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H
1-633	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H
1-634	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H
1-635	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-636	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H
1-637	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H	
1-638	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-639	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-640	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-641	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-642	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H	
1-643	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-644	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H	
1-645	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-646	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H	
1-647	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-648	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-649	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-650	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-651	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-652	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-653	H	H	H	Me	2	-CH=CH-cHx	H	H	
1-654	H	H	H	Me	2	-CH=CH-Ph	H	H	
1-655	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-656	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-657	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-658	H	H	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-659	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-660	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-661	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H	
1-662	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	
1-663	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	
1-664	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	

10

20

30

40

1-665	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-666	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-667	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-668	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-669	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-670	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-671	H	H	Me	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-672	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-673	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-674	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-675	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-676	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-677	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-678	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-679	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-680	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-681	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-682	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-683	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-684	H	H	Me	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-685	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-686	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-687	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-688	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-689	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-690	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-691	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-692	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-693	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H

1-694	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-695	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-696	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-697	H	H	Me	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-698	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-699	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-700	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-701	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-702	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-703	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-704	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-705	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-706	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-707	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-708	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-709	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-710	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-711	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-712	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-713	H	H	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-714	H	H	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-715	H	H	H	H	Me	2	-C=C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-716	H	H	H	H	Me	2	-C=C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-717	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H
1-718	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-cHx	H	H
1-719	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H
1-720	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H
1-721	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-cHx)	H	H
1-722	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-723	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Et-cHx)	H	H
1-724	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-725	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-cHx)	H	H
1-726	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-cHx)	H	H
1-727	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeS-cHx)	H	H
1-728	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-cHx)	H	H
1-729	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-cHx)	H	H
1-730	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-731	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-732	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-733	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-734	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-Ph)	H	H
1-735	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-Ph)	H	H
1-736	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Pr-Ph)	H	H
1-737	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Bu-Ph)	H	H
1-738	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-Ph)	H	H
1-739	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-Ph)	H	H
1-740	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-PrO-Ph)	H	H
1-741	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-Ph)	H	H
1-742	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-Ph)	H	H
1-743	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-744	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-745	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-746	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-747	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-748	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-749	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-750	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-751	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-752	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-753	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-754	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-755	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-756	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-757	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-758	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-759	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-760	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-761	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-762	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-763	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-764	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-765	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-766	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-767	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-768	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-769	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cPn	H	H
1-770	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-771	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	Me	H
1-772	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	Me
1-773	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	F	H
1-774	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	F
1-775	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-776	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-777	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-778	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-cHx)	H	H
1-779	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-780	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H

1-781	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-782	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-783	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-784	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-785	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-786	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-787	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-788	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-789	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-790	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-791	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-792	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-793	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-794	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-795	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-796	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-797	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-798	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-799	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-800	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-801	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-(2-Et-PrO)-cHx)	H	H
1-802	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-(2-Et-PrO)-cHx)	H	H
1-803	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-804	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-805	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-806	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-807	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-808	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-809	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-810	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-811	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H	
1-812	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H	
1-813	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-(2-Et-PrS)-cHx)	H	H	
1-814	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-(2-Et-PrS)-cHx)	H	H	
1-815	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H	
1-816	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H	
1-817	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H	
1-818	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	
1-819	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H	
1-820	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	
1-821	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H	
1-822	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H	
1-823	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H	
1-824	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-825	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	Me	H	
1-826	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	Me	
1-827	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	F	H	
1-828	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	F	
1-829	H	H	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-830	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-831	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-832	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-Ph)	H	H	
1-833	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H	
1-834	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	
1-835	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-Ph)	H	H	
1-836	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	
1-837	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	
1-838	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H	

10

30

40

1-839	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-840	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H
1-841	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-842	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H
1-843	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-844	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-845	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-846	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-847	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-848	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-849	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-850	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-851	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-852	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-853	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-854	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-855	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-856	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-857	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-858	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-859	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-860	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-861	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-862	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H
1-863	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H
1-864	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H
1-865	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H
1-866	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H
1-867	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H

10

30

40

1-868	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-869	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-870	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3-iBuS-Ph]	H	H	
1-871	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[4-iBuS-Ph]	H	H	
1-872	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3-cHx-Ph]	H	H	
1-873	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[4-cHx-Ph]	H	H	
1-874	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3-Ph-Ph]	H	H	10
1-875	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[4-Ph-Ph]	H	H	
1-876	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[2,4-diMe-Ph]	H	H	
1-877	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3,4-diMe-Ph]	H	H	
1-878	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -[3,5-diMe-Ph]	H	H	
1-879	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Np(1)	H	H	
1-880	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Np(2)	H	H	
1-881	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cPn	H	H	20
1-882	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-883	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	Me	H	
1-884	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	Me	
1-885	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	F	H	
1-886	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	F	
1-887	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-888	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	30
1-889	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-890	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-F-cHx]	H	H	
1-891	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-F-cHx]	H	H	
1-892	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Cl-cHx]	H	H	
1-893	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Br-cHx]	H	H	
1-894	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Me-cHx]	H	H	
1-895	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Me-cHx]	H	H	40
1-896	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Et-cHx]	H	H	

1-897	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-898	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-899	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-900	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-901	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-902	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-903	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-904	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-905	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-906	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-907	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-908	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-909	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-910	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-911	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-912	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-913	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-(2-Et-PrO)-cHx)	H	H
1-914	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-(2-Et-PrO)-cHx)	H	H
1-915	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-916	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-917	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-918	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-919	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-920	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-921	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-922	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-923	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-924	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-925	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-(2-Et-PrS)-cHx)	H	H

1-926	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	
1-927	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-iBuS-cHx]	H	H	
1-928	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-iBuS-cHx]	H	H	
1-929	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-cHx-cHx]	H	H	
1-930	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-cHx-cHx]	H	H	
1-931	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Ph-cHx]	H	H	
1-932	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Ph-cHx]	H	H	10
1-933	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[2,4-diMe-cHx]	H	H	
1-934	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3,4-diMe-cHx]	H	H	
1-935	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3,5-diMe-cHx]	H	H	
1-936	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-937	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	Me	H	
1-938	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	Me	
1-939	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	F	H	20
1-940	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	F	
1-941	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-942	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-943	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-944	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-F-Ph]	H	H	
1-945	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-F-Ph]	H	H	
1-946	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Cl-Ph]	H	H	30
1-947	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Br-Ph]	H	H	
1-948	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Me-Ph]	H	H	
1-949	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Me-Ph]	H	H	
1-950	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Et-Ph]	H	H	
1-951	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Et-Ph]	H	H	
1-952	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-Pr-Ph]	H	H	
1-953	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-Pr-Ph]	H	H	40
1-954	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-iPr-Ph]	H	H	

1-955	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-956	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-957	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-958	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-959	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-960	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-961	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-962	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-963	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-964	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-965	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-966	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-967	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-968	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-969	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-970	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-971	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-972	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-973	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-974	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H
1-975	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H
1-976	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H
1-977	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H
1-978	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H
1-979	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H
1-980	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-981	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-982	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H
1-983	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-984	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H
1-985	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-986	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H
1-987	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-988	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-989	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-990	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-991	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Np(1)	H	H
1-992	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Np(2)	H	H
1-993	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-994	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-995	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-996	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-997	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-998	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-999	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1000	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1001	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1002	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1003	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1004	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1005	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1006	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1007	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1008	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1009	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1010	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1011	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1012	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H

10

30

40

1-1013	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1014	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1015	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1016	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1017	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1018	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1019	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1020	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1021	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1022	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1023	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1024	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1025	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1026	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1027	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1028	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1029	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1030	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1031	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1032	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1033	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1034	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1035	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1036	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1037	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1038	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1039	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1040	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1041	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H

1-1042	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1043	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1044	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1045	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-cHx	H	H	
1-1046	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-cHx	H	H
1-1047	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-cHx	H	H
1-1048	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-cHx	H	H
1-1049	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-F-cHx)	H	H	
1-1050	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Me-cHx)	H	H	
1-1051	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Et-cHx)	H	H	
1-1052	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	
1-1053	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-MeO-cHx)	H	H	
1-1054	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-EtO-cHx)	H	H	
1-1055	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-MeS-cHx)	H	H	
1-1056	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-cHx-cHx)	H	H	
1-1057	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Ph-cHx)	H	H	
1-1058	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-Ph	H	H	
1-1059	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-Ph	H	H
1-1060	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-Ph	H	H
1-1061	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-Ph	H	H
1-1062	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-F-Ph)	H	H	
1-1063	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Me-Ph)	H	H	
1-1064	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Et-Ph)	H	H	
1-1065	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1066	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-MeO-Ph)	H	H	
1-1067	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-EtO-Ph)	H	H	
1-1068	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1069	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1070	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -0-(4-Ph-Ph)	H	H	

10

20

30

40

1-1071	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cPn	H	H
1-1072	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-1073	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	Me	H	
1-1074	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	Me	
1-1075	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	F	H	
1-1076	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	F	
1-1077	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
1-1078	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
1-1079	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
1-1080	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-F-cHx)	H	H
1-1081	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-F-cHx)	H	H	
1-1082	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Cl-cHx)	H	H	
1-1083	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Br-cHx)	H	H	
1-1084	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-Me-cHx)	H	H	
1-1085	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Me-cHx)	H	H	
1-1086	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-Et-cHx)	H	H	
1-1087	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Et-cHx)	H	H	
1-1088	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-Pr-cHx)	H	H	
1-1089	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Pr-cHx)	H	H	
1-1090	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iPr-cHx)	H	H	
1-1091	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-Bu-cHx)	H	H	
1-1092	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Bu-cHx)	H	H	
1-1093	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	
1-1094	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	
1-1095	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-MeO-cHx)	H	H	
1-1096	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-MeO-cHx)	H	H	
1-1097	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-EtO-cHx)	H	H	
1-1098	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-EtO-cHx)	H	H	
1-1099	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-PrO-cHx)	H	H	

1-1100	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Pr0-cHx)	H	H	
1-1101	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-iPr0-cHx)	H	H	
1-1102	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iPr0-cHx)	H	H	
1-1103	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-[3-(2-Et-Pr0)-cHx]	H	H	
1-1104	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-[4-(2-Et-Pr0)-cHx]	H	H	
1-1105	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-iBu0-cHx)	H	H	
1-1106	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iBu0-cHx)	H	H	10
1-1107	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-MeS-cHx)	H	H	
1-1108	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-MeS-cHx)	H	H	
1-1109	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-EtS-cHx)	H	H	
1-1110	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-EtS-cHx)	H	H	
1-1111	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-PrS-cHx)	H	H	
1-1112	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-PrS-cHx)	H	H	
1-1113	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-iPrS-cHx)	H	H	20
1-1114	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iPrS-cHx)	H	H	
1-1115	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	
1-1116	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	
1-1117	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-iBuS-cHx)	H	H	
1-1118	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iBuS-cHx)	H	H	
1-1119	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-cHx-cHx)	H	H	
1-1120	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-cHx-cHx)	H	H	30
1-1121	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-Ph-cHx)	H	H	
1-1122	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Ph-cHx)	H	H	
1-1123	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(2,4-d1Me-cHx)	H	H	
1-1124	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3,4-d1Me-cHx)	H	H	
1-1125	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3,5-d1Me-cHx)	H	H	
1-1126	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-1127	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	Me	H	40
1-1128	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	Me	

1-1129	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	F	H
1-1130	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	F	
1-1131	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1132	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1133	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1134	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-F-Ph)	H	H
1-1135	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-Ph)	H	H
1-1136	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1137	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-Ph)	H	H
1-1138	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Me-Ph)	H	H
1-1139	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1140	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Et-Ph)	H	H
1-1141	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1142	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1143	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1144	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1145	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1146	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1147	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1148	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1149	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1150	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1151	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1152	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1153	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1154	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1155	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1156	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1157	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-Ph)	H	H

1-1158	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	
1-1159	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	
1-1160	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iBuO-Ph)	H	H	
1-1161	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iBuO-Ph)	H	H	
1-1162	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-MeS-Ph)	H	H	
1-1163	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1164	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-EtS-Ph)	H	H	10
1-1165	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtS-Ph)	H	H	
1-1166	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-PrS-Ph)	H	H	
1-1167	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrS-Ph)	H	H	
1-1168	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iPrS-Ph)	H	H	
1-1169	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrS-Ph)	H	H	
1-1170	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-1171	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	20
1-1172	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-1173	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-1174	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-cHx-Ph)	H	H	
1-1175	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1176	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Ph-Ph)	H	H	
1-1177	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1178	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	30
1-1179	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1180	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-1181	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-cHx	H	H	
1-1182	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-Ph	H	H	
1-1183	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> O-cHx	H	H	
1-1184	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> O-Ph	H	H	
1-1185	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	40
1-1186	H	H	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	

1-1187	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1188	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1189	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1190	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1191	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1192	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1193	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1194	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1195	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1196	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1197	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1198	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1199	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1200	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1201	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1202	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1203	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1204	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1205	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1206	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1207	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1208	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1209	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1210	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1211	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cPn	H	H
1-1212	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1213	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	Me	H
1-1214	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	Me
1-1215	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	F	H

10

20

30

40

1-1216	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	F
1-1217	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1218	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1219	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1220	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-cHx)	H	H
1-1221	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1222	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-1223	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-1224	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-1225	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1226	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-1227	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1228	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-1229	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-1230	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-1231	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-1232	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-1233	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1234	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1235	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-1236	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1237	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-1238	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1239	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-1240	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-1241	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1242	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1243	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrO)cHx)	H	H
1-1244	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrO)cHx)	H	H

10

20

30

40

1-1245	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBu0-cHx)	H	H
1-1246	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-1Bu0-cHx)	H	H
1-1247	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-1248	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1249	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-1250	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-1251	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-1252	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-1253	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-1PrS-cHx)	H	H
1-1254	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-1PrS-cHx)	H	H
1-1255	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrS)cHx)	H	H
1-1256	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrS)cHx)	H	H
1-1257	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-1BuS-cHx)	H	H
1-1258	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1259	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H
1-1260	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1261	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H
1-1262	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1263	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1264	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1265	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1266	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1267	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	Me	H
1-1268	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	Me
1-1269	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	F	H
1-1270	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	F
1-1271	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1272	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1273	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

1-1274	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1275	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1276	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1277	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1278	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1279	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1280	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-1281	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1282	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H
1-1283	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-1284	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H
1-1285	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-1286	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-1287	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-1288	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1289	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1290	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1291	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1292	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-1293	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1294	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-1295	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-1296	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1297	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1298	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrO)Ph)	H	H
1-1299	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrO)Ph)	H	H
1-1300	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-1301	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1302	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-1303	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1304	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H	
1-1305	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H	
1-1306	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H	
1-1307	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H	
1-1308	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H	
1-1309	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H	10
1-1310	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrS)Ph)	H	H	
1-1311	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrS)Ph)	H	H	
1-1312	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-1313	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-1314	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H	
1-1315	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1316	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H	20
1-1317	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1318	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1319	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1320	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-1321	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1322	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1323	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	30
1-1324	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1325	H	H	H	Me	2	-CO-CH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1326	H	H	H	Me	2	-CO-CH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1327	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1328	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1329	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-1330	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	40
1-1331	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	

1-1332	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1333	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1334	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1335	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1336	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1337	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1338	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1339	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1340	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1341	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1342	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1343	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1344	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1345	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1346	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1347	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1348	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1349	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1350	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1351	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1352	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1353	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1354	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1355	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1356	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1357	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1358	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1359	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1360	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H

10

20

30

40

1-1361	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1362	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1363	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1364	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1365	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1366	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1367	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1368	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1369	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1370	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1371	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1372	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1373	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1374	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1375	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1376	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1377	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1378	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1379	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1380	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1381	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1382	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1383	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1384	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1385	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-1386	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-1387	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H
1-1388	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H
1-1389	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H

10

20

30

40

1-1390	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H
1-1391	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H
1-1392	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1393	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1394	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1395	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1396	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1397	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1398	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1399	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1400	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H
1-1401	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H
1-1402	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H
1-1403	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H
1-1404	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H
1-1405	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1406	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1407	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1408	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1409	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1410	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1411	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1412	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1413	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cPn	H	H
1-1414	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H
1-1415	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	Me	H
1-1416	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	Me
1-1417	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	F	H
1-1418	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	F

1-1419	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-cHx	H	H
1-1420	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-cHx	H	H
1-1421	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-cHx	H	H
1-1422	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-F-cHx)	H	H
1-1423	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-F-cHx)	H	H
1-1424	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1425	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Br-cHx)	H	H
1-1426	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-Me-cHx)	H	H
1-1427	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Me-cHx)	H	H
1-1428	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-Et-cHx)	H	H
1-1429	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Et-cHx)	H	H
1-1430	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-Pr-cHx)	H	H
1-1431	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1432	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1433	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-Bu-cHx)	H	H
1-1434	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1435	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1436	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1437	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-MeO-cHx)	H	H
1-1438	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1439	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-EtO-cHx)	H	H
1-1440	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1441	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-PrO-cHx)	H	H
1-1442	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1443	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1444	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1445	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1446	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1447	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(3-iBuO-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-1448	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1449	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1450	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1451	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-cHx)	H	H
1-1452	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-cHx)	H	H
1-1453	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-cHx)	H	H
1-1454	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-cHx)	H	H
1-1455	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1456	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1457	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1458	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1459	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1460	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1461	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-cHx)	H	H
1-1462	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1463	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-cHx)	H	H
1-1464	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1465	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1466	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1467	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1468	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H
1-1469	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	Me	H
1-1470	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	Me
1-1471	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	F	H
1-1472	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	F
1-1473	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H
1-1474	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H
1-1475	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H
1-1476	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-1477	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H
1-1478	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1479	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Br-Ph)	H	H
1-1480	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H
1-1481	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1482	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Et-Ph)	H	H
1-1483	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1484	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1485	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1486	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1487	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1488	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1489	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1490	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1491	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1492	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1493	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1494	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1495	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1496	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1497	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1498	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1499	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1500	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1501	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1502	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-1503	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1504	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1505	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-1506	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-Ph)	H	H
1-1507	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-Ph)	H	H	
1-1508	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-Ph)	H	H	
1-1509	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-Ph)	H	H	
1-1510	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-Ph)	H	H	
1-1511	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-Ph)	H	H	
1-1512	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-1513	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	
1-1514	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-1515	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-1516	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-Ph)	H	H	
1-1517	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1518	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-Ph)	H	H	
1-1519	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1520	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1521	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1522	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-1523	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-cHx	H	H	
1-1524	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H	
1-1525	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-cHx	H	H	
1-1526	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-Ph	H	H	
1-1527	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1528	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1529	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1530	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1531	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H	
1-1532	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	
1-1533	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	
1-1534	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	

1-1535	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1536	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	
1-1537	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	
1-1538	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	
1-1539	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	
1-1540	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1541	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1542	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1543	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1544	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H	
1-1545	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	
1-1546	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	
1-1547	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1548	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-1549	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	
1-1550	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1551	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1552	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1553	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -cPn	H	H	
1-1554	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1555	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	Me	H	
1-1556	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	Me	
1-1557	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	F	H	
1-1558	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	F	
1-1559	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1560	COMe	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1561	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1562	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-cHx)	H	H	
1-1563	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H	

1-1564	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-1565	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-1566	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-1567	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1568	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-1569	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1570	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-1571	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-1572	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-1573	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-1574	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-1575	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1576	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1577	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-1578	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1579	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-1580	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1581	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-1582	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-1583	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1584	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1585	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrO)cHx)	H	H
1-1586	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrO)cHx)	H	H
1-1587	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1588	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1589	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-1590	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1591	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-1592	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-1593	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-1594	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-1595	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1596	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1597	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1598	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1599	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1600	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1601	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H
1-1602	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1603	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H
1-1604	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1605	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1606	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1607	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1608	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1609	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	Me	H
1-1610	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	Me
1-1611	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	F	H
1-1612	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	F
1-1613	H	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1614	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1615	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1616	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1617	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1618	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1619	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1620	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1621	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H

1-1622	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-1623	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	
1-1624	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H	
1-1625	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H	
1-1626	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H	
1-1627	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H	
1-1628	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H	
1-1629	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H	
1-1630	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1631	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1632	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	
1-1633	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-1634	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H	
1-1635	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	
1-1636	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H	
1-1637	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H	
1-1638	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H	
1-1639	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H	
1-1640	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrO)Ph)	H	H	
1-1641	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrO)Ph)	H	H	
1-1642	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H	
1-1643	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H	
1-1644	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H	
1-1645	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1646	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H	
1-1647	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H	
1-1648	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H	
1-1649	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H	
1-1650	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H	

10

20

30

40

1-1651	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1652	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-(2-Et-PrS)Ph)	H	H	
1-1653	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-(2-Et-PrS)Ph)	H	H	
1-1654	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H	
1-1655	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H	
1-1656	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H	
1-1657	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1658	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H	
1-1659	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1660	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1661	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-1662	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-1663	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1664	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1665	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1666	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1667	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1668	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1669	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	
1-1670	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	
1-1671	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-1672	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-1673	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-1674	H	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-1675	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1676	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1677	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H	
1-1678	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	
1-1679	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	

1-1680	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1681	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	
1-1682	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	
1-1683	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	
1-1684	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	
1-1685	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	
1-1686	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-1687	H	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-1688	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-1689	CO <sub>2</sub> Et	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-1690	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H	
1-1691	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	
1-1692	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	
1-1693	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1694	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-1695	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	
1-1696	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1697	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1698	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1699	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-1700	H	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-1701	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-1702	CO <sub>2</sub> Et	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-1703	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H	
1-1704	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	
1-1705	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	
1-1706	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	
1-1707	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	
1-1708	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	

1-1709	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1710	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	
1-1711	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	
1-1712	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	
1-1713	H	H	Me	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1714	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1715	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1716	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H	
1-1717	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	
1-1718	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	
1-1719	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-1720	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-1721	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	
1-1722	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-1723	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	
1-1724	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	
1-1725	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	
1-1726	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	
1-1727	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H	
1-1728	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H	
1-1729	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	
1-1730	H	H	Me	Me	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-1731	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-1732	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-1733	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-F-Ph	H	H	
1-1734	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-F-Ph	H	H	
1-1735	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diF-Ph	H	H	
1-1736	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Cl-Ph	H	H	
1-1737	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Cl-Ph	H	H	

10

20

30

40

1-1738	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diCl-Ph	H	H	
1-1739	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Me-Ph	H	H	
1-1740	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Me-Ph	H	H	
1-1741	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diMe-Ph	H	H	
1-1742	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H	
1-1743	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]Ph	H	H	
1-1744	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	10
1-1745	H	H	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
1-1746	CO <sub>2</sub> Me	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
1-1747	CO <sub>2</sub> Et	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
1-1748	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	
1-1749	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	
1-1750	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	
1-1751	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	20
1-1752	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	
1-1753	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H	
1-1754	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	
1-1755	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	
1-1756	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	
1-1757	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H	
1-1758	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H	30
1-1759	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-1760	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-1761	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-1762	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-1763	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPh	H	H	
1-1764	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-1765	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	Me	H	40
1-1766	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	Me	

1-1767	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	F	H
1-1768	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	F
1-1769	H	H	Me	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1770	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1771	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1772	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1773	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-1774	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-1775	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1776	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1777	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-1778	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-1779	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1780	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1781	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1782	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-1783	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1784	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-1785	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1786	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1787	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1788	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1789	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1790	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	Me	H
1-1791	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	Me
1-1792	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	F	H
1-1793	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	F
1-1794	H	H	Me	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1795	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

1-1796	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1797	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1798	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1799	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1800	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1801	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1802	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-1803	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-1804	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-1805	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1806	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1807	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1808	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-1809	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1810	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-1811	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1812	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1813	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1814	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1815	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cPn	H	H
1-1816	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1817	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	Me	H
1-1818	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	Me
1-1819	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	F	H
1-1820	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	F
1-1821	H	H	Me	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1822	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1823	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1824	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-1825	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-CHx)	H	H
1-1826	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-CHx)	H	H
1-1827	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-CHx)	H	H
1-1828	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-CHx)	H	H
1-1829	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-CHx)	H	H
1-1830	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPr-CHx)	H	H
1-1831	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-CHx)	H	H
1-1832	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -CHx)	H	H
1-1833	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-CHx)	H	H
1-1834	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-CHx)	H	H
1-1835	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-CHx)	H	H
1-1836	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrO-CHx)	H	H
1-1837	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-CHx)	H	H
1-1838	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-CHx)	H	H
1-1839	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(2,4-diMe-CHx)	H	H
1-1840	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,4-diMe-CHx)	H	H
1-1841	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,5-diMe-CHx)	H	H
1-1842	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1843	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	Me	H
1-1844	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	Me
1-1845	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	F	H
1-1846	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	F
1-1847	H	H	Me	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1848	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1849	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1850	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1851	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1852	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1853	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-1854	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1855	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-1856	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-1857	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-1858	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1859	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1860	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1861	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-1862	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1863	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-1864	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1865	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1866	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1867	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1868	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-1869	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-1870	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-cHx	H	H
1-1871	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-Ph	H	H
1-1872	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1873	H	H	Me	Me	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1874	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1875	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1876	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1877	H	H	Me	Me	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1878	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1879	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1880	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1881	H	H	Me	Me	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1882	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

10

30

40

1-1883	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1884	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1885	H	H	Me	Me	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1886	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1887	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1888	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-1889	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1890	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-1891	H	H	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1892	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1893	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1894	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1895	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1896	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1897	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1898	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1899	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1900	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1901	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1902	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1903	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1904	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1905	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1906	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1907	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1908	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cPn	H	H
1-1909	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1910	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	Me	H
1-1911	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	Me

1-1912	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	F	H
1-1913	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	F
1-1914	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1915	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1916	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1917	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1918	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-1919	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-1920	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1921	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1922	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-1923	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-1924	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-1925	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1926	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1927	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1928	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-1929	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1930	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-1931	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1932	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2, 4-diMe-cHx)	H	H
1-1933	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3, 4-diMe-cHx)	H	H
1-1934	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3, 5-diMe-cHx)	H	H
1-1935	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1936	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	Me	H
1-1937	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	Me
1-1938	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	F	H
1-1939	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	F
1-1940	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

1-1941	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1942	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1943	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1944	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1945	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1946	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1947	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1948	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-1949	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-1950	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-1951	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1952	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1953	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1954	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-1955	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1956	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-1957	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1958	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1959	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1960	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1961	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cPn	H	H
1-1962	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1963	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	Me	H
1-1964	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	Me
1-1965	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	F	H
1-1966	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	F
1-1967	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1968	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1969	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

10

30

40

1-1970	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-CHx)	H	H
1-1971	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-CHx)	H	H
1-1972	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Br-CHx)	H	H
1-1973	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-CHx)	H	H
1-1974	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-CHx)	H	H
1-1975	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Pr-CHx)	H	H
1-1976	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-CHx)	H	H
1-1977	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-CHx)	H	H
1-1978	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -CHx)	H	H
1-1979	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-CHx)	H	H
1-1980	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-CHx)	H	H
1-1981	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-CHx)	H	H
1-1982	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-CHx)	H	H
1-1983	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-CHx)	H	H
1-1984	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(2,4-diMe-CHx)	H	H
1-1985	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-CHx)	H	H
1-1986	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-CHx)	H	H
1-1987	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1988	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	Me	H
1-1989	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	Me
1-1990	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	F	H
1-1991	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	F
1-1992	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1993	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1994	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1995	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1996	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1997	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1998	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-1999	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-2000	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-2001	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-2002	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-2003	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2004	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-2005	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-2006	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-2007	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-2008	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-2009	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-2010	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-2011	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2012	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2013	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2014	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2015	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2016	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2017	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2018	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2019	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2020	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2021	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-2022	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-2023	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-2024	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-2025	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-2026	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-2027	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H

10

30

40

1-2028	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-2029	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2030	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2031	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2032	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2033	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2034	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2035	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2036	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2037	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cPn	H	H
1-2038	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2039	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	Me	H
1-2040	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	Me
1-2041	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	F	H
1-2042	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	F
1-2043	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2044	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2045	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2046	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-cHx)	H	H
1-2047	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-cHx)	H	H
1-2048	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-cHx)	H	H
1-2049	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-cHx)	H	H
1-2050	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-cHx)	H	H
1-2051	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-cHx)	H	H
1-2052	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-cHx)	H	H
1-2053	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-cHx)	H	H
1-2054	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-2055	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-2056	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-cHx)	H	H

10

20

30

40

1-2057	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-cHx)	H	H
1-2058	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-2059	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-2060	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-2061	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-2062	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-2063	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-2064	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2065	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	Me	H
1-2066	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	Me
1-2067	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	F	H
1-2068	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	F
1-2069	H	H	Me	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2070	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2071	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2072	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-Ph)	H	H
1-2073	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-2074	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-Ph)	H	H
1-2075	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-Ph)	H	H
1-2076	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-Ph)	H	H
1-2077	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-2078	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-2079	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-2080	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2081	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-2082	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-2083	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-2084	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-2085	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-Ph)	H	H

1-2086	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-2087	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2088	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2089	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2090	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2091	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2092	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2093	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2094	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2095	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2096	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2097	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2098	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2099	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2100	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2101	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2102	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2103	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2104	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2105	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2106	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2107	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2108	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2109	H	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2110	H	H	Me	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2111	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2112	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2113	H	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2114	H	H	Me	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

10

20

30

40

1-2115	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2116	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2117	H	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2118	H	H	Me	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2119	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2120	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2121	H	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2122	H	H	Me	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2123	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2124	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2125	H	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2126	H	H	Me	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2127	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2128	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2129	H	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2130	H	H	Me	Me	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2131	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2132	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2133	H	H	H	H	Et	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H
1-2134	H	H	H	H	Et	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]Ph	H	H
1-2135	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2136	H	H	Me	Me	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2137	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2138	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2139	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H
1-2140	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H
1-2141	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H
1-2142	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H
1-2143	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-2144	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
1-2145	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
1-2146	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
1-2147	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
1-2148	H	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H
1-2149	H	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H
1-2150	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2151	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2152	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-2153	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-2154	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2155	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2156	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2157	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2158	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2159	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2160	CO <sub>2</sub> Bt	H	H	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2161	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2162	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2163	H	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2164	H	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2165	H	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
1-2166	H	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	
1-2167	H	H	H	Me	3	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2168	H	H	H	Me	3	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2169	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2170	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2171	H	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2172	H	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	

10

20

30

40

1-2173	H	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2174	H	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2175	H	H	H	Me	3	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2176	H	H	H	Me	3	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2177	H	H	H	Me	3	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-2178	H	H	H	Me	3	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-2179	H	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cPn	H	H
1-2180	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cPn	H	H
1-2181	H	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2182	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-2183	H	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2184	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-2185	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-2186	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-d1F-Ph)	H	H
1-2187	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-d1F-Ph)	H	H
1-2188	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-C1-Ph)	H	H
1-2189	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-C1-Ph)	H	H
1-2190	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-d1C1-Ph)	H	H
1-2191	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-d1C1-Ph)	H	H
1-2192	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-2193	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-d1Me-Ph)	H	H
1-2194	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-d1Me-Ph)	H	H
1-2195	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2196	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-d1CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2197	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-d1CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2198	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-2199	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-d1MeO-Ph)	H	H
1-2200	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-d1MeO-Ph)	H	H
1-2201	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H

1-2202	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-2203	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-2204	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2205	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2206	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-C1-Ph)	H	H
1-2207	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diC1-Ph)	H	H
1-2208	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diC1-Ph)	H	H
1-2209	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2210	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2211	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2212	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2213	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2214	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-2215	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-2216	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H
1-2217	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2218	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2219	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H
1-2220	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2221	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2222	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2223	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2224	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2225	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-2226	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2227	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2228	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2229	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ac-Ph)	H	H
1-2230	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ac-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-2231	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,4-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2232	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,5-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2233	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,4-\text{diMeO-Ph})$	H	H
1-2234	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,5-\text{diMeO-Ph})$	H	H
1-2235	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,4,5-\text{triMeO-Ph})$	H	H
1-2236	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3-\text{Ac-Ph})$	H	H
1-2237	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(4-\text{Ac-Ph})$	H	H
1-2238	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{F-Ph})$	H	H
1-2239	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2240	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2241	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{Cl-Ph})$	H	H
1-2242	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Cl-Ph})$	H	H
1-2243	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4-\text{diCl-Ph})$	H	H
1-2244	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5-\text{diCl-Ph})$	H	H
1-2245	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{Me-Ph})$	H	H
1-2246	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4-\text{diMe-Ph})$	H	H
1-2247	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5-\text{diMe-Ph})$	H	H
1-2248	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-2249	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4-\text{diCF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-2250	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5-\text{diCF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-2251	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{MeO-Ph})$	H	H
1-2252	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4-\text{diMeO-Ph})$	H	H
1-2253	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5-\text{diMeO-Ph})$	H	H
1-2254	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4,5-\text{triMeO-Ph})$	H	H
1-2255	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3-\text{Ac-Ph})$	H	H
1-2256	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Ac-Ph})$	H	H
1-2257	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2258	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5-\text{diF-Ph})$	H	H
1-2259	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{Cl-Ph})$	H	H

1-2260	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2261	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2262	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2263	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2264	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2265	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2266	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2267	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-2268	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-2269	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H
1-2270	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2271	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2272	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-Cl-Ph)	H	H
1-2273	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-2274	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2275	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2276	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H
1-2277	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-2278	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2279	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2280	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2281	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2282	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2283	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-2284	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2285	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2286	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2287	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(3-Ac-Ph)	H	H
1-2288	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(4-Ac-Ph)	H	H

10

20

30

40

1-2289	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -O-(4-CO <sub>2</sub> H-Ph)	H	H
1-2290	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2291	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2292	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3-Cl-Ph)	H	H
1-2293	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2294	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2295	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2296	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2297	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2298	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2299	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2300	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(3-Ac-Ph)	H	H
1-2301	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ac-Ph)	H	H
1-2302	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-2303	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-2304	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2305	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2306	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-2307	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-2308	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2309	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2310	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-2311	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-2312	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2313	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2314	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-2315	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-2316	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2317	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H

1-2318	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2319	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-2320	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	
1-2321	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	
1-2322	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	
1-2323	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	
1-2324	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	
1-2325	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	
1-2326	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	
1-2327	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	
1-2328	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H	
1-2329	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	
1-2330	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	
1-2331	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H	
1-2332	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	
1-2333	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H	
1-2334	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H	
1-2335	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	
1-2336	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	
1-2337	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	
1-2338	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-2339	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-2340	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	
1-2341	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	
1-2342	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	
1-2343	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	
1-2344	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	
1-2345	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	
1-2346	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	

10

20

30

40

1-2347	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-2348	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-2349	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2350	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-2351	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-2352	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-2353	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2354	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2355	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-2356	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-2357	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2358	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2359	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-2360	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-2361	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2362	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2363	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2364	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2365	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-2366	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-2367	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2368	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2369	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2370	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-2371	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-2372	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-2373	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-2374	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-2375	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H

1-2376	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-2377	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-2378	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-2379	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-2380	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-2381	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-2382	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-2383	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2384	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2385	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-2386	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-2387	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-2388	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-2389	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-2390	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-2391	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-2392	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2393	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2394	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2395	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2396	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2397	H	H	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2398	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2399	COCH <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2400	COCH <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2401	COCH <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2402	COCH <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2403	COCH <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2404	COCH <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

1-2405	CO <sub>2</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2406	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2407	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2408	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2409	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2410	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2411	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2412	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2413	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2414	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2415	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2416	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2417	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2418	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2419	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2420	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2421	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2422	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2423	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2424	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2425	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2426	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2427	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2428	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2429	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2430	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2431	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2432	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2433	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H

10

20

30

40

1-2434	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2435	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2436	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2437	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-2438	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2439	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2440	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2441	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2442	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2443	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2444	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2445	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-2446	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2447	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2448	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2449	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2450	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2451	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2452	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2453	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-2454	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2455	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2456	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2457	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2458	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2459	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2460	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2461	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-2462	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

10

20

30

40

1-2463	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2464	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2465	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2466	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2467	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2468	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2469	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	10
1-2470	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2471	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2472	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2473	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2474	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2475	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2476	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	20
1-2477	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2478	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2479	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2480	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2481	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2482	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2483	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	30
1-2484	CO <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2485	CO <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
1-2486	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2487	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2488	CO <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2489	CO <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2490	CO <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	40
1-2491	CO <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	

1-2492	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2493	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
1-2494	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2495	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2496	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2497	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2498	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	10
1-2499	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2500	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2501	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
1-2502	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2503	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2504	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2505	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	20
1-2506	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2507	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2508	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2509	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
1-2510	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2511	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2512	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	30
1-2513	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2514	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2515	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2516	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2517	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
1-2518	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	40
1-2519	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
1-2520	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	

1-2521	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2522	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2523	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2524	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2525	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2526	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2527	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2528	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2529	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2530	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2531	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2532	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2533	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-2534	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2535	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2536	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2537	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2538	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2539	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2540	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2541	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-2542	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2543	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2544	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2545	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2546	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2547	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2548	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-2549	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H

10

20

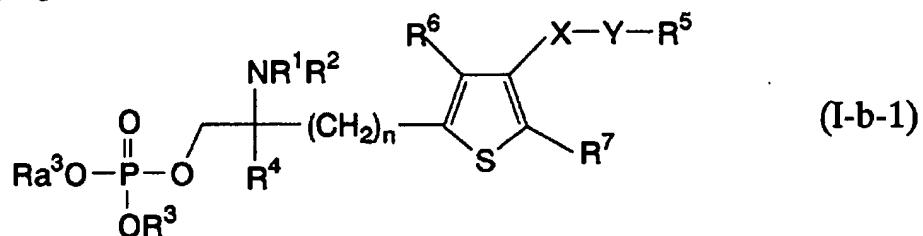
30

40

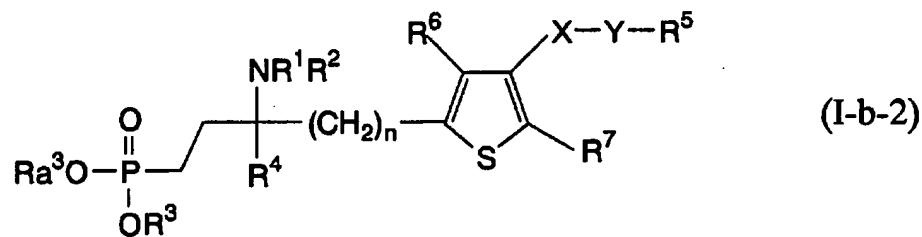
1-2550	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2551	COCH <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2552	COCH <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2553	COCH <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2554	COCH <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2555	COCH <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2556	COCH <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-2557	COCH <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H

10

表 2  
【0063】  
【化8】



又は



20

30

【0064】  
【表2】

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sub>a</sub> <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-X-Y-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
2-1	H	H	H	H	Me	1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-2	H	H	H	H	Me	1	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-3	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-4	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-5	H	H	H	H	Me	1	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-6	H	H	H	H	Me	1	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-7	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-8	H	H	H	H	Me	1	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-9	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-10	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-11	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-12	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-13	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPn	H	H
2-14	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-15	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	Me	H
2-16	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	Me
2-17	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	F	H
2-18	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	F
2-19	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-20	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-21	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-22	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
2-23	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
2-24	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
2-25	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
2-26	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H

10

20

30

40

2-27	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
2-28	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
2-29	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
2-30	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
2-31	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
2-32	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
2-33	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
2-34	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
2-35	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
2-36	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-37	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-38	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-39	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-40	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	Me	H
2-41	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	Me
2-42	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	F	H
2-43	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	F
2-44	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-45	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-46	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-47	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
2-48	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
2-49	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
2-50	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
2-51	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
2-52	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
2-53	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
2-54	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
2-55	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H

10

20

30

40

2-56	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
2-57	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
2-58	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
2-59	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
2-60	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
2-61	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
2-62	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-63	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-64	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-65	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cPn	H	H
2-66	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-67	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	Me	H
2-68	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	Me
2-69	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	F	H
2-70	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	F
2-71	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-72	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-73	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-74	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-cHx)	H	H
2-75	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
2-76	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
2-77	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
2-78	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
2-79	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
2-80	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
2-81	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
2-82	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
2-83	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
2-84	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H

10

20

30

40

2-85	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
2-86	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-1PrO-cHx)	H	H
2-87	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
2-88	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
2-89	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-90	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-91	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-92	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-93	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	Me	H
2-94	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	Me
2-95	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	F	H
2-96	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	F
2-97	H	H	Me	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-98	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-99	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-100	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-F-Ph)	H	H
2-101	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
2-102	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
2-103	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
2-104	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
2-105	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
2-106	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-1Pr-Ph)	H	H
2-107	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
2-108	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
2-109	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
2-110	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
2-111	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
2-112	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(4-1PrO-Ph)	H	H
2-113	H	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H

10

20

30

40

2-114	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_6$ -(4-MeS-Ph)	H	H
2-115	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_6$ -(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-116	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_6$ -(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-117	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_6$ -(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-118	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_7$ -cHx	H	H
2-119	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_7$ -Ph	H	H
2-120	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_8$ -cHx	H	H
2-121	H	H	H	H	Me	2	- $(\text{CH}_2)_8$ -Ph	H	H
2-122	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -cHx	H	H
2-123	H	H	Me	Me	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -cHx	H	H
2-124	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -cHx	H	H
2-125	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -cHx	H	H
2-126	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -Ph	H	H
2-127	H	H	Me	Me	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -Ph	H	H
2-128	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -Ph	H	H
2-129	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_3$ -Ph	H	H
2-130	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -cHx	H	H
2-131	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -cHx	H	H
2-132	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -cHx	H	H
2-133	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -cHx	H	H
2-134	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -Ph	H	H
2-135	H	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -Ph	H	H
2-136	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -Ph	H	H
2-137	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH=CH- $(\text{CH}_2)_4$ -Ph	H	H
2-138	H	H	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-139	H	H	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-140	H	H	H	H	Me	2	-C=C- $(\text{CH}_2)_2$ O-cHx	H	H
2-141	H	H	H	H	Me	2	-C=C- $(\text{CH}_2)_2$ O-Ph	H	H
2-142	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H

10

30

40

2-143	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-144	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-145	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-146	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-147	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-148	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-149	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-150	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-151	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-152	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-153	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
2-154	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-155	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-156	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-157	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-158	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cPi	H	H
2-159	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-160	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	Me	H
2-161	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	Me
2-162	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	F	H
2-163	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	F
2-164	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-165	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-166	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-167	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H
2-168	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
2-169	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
2-170	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
2-171	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H

10

20

30

40

2-172	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
2-173	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
2-174	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
2-175	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
2-176	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
2-177	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
2-178	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
2-179	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
2-180	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
2-181	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
2-182	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-183	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-184	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-185	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-186	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	Me	H
2-187	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	Me
2-188	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	F	H
2-189	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	F
2-190	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-191	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-192	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-193	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
2-194	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
2-195	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
2-196	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
2-197	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
2-198	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
2-199	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
2-200	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H

10

30

40

2-201	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
2-202	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
2-203	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
2-204	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
2-205	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
2-206	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
2-207	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
2-208	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-209	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-210	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-211	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cPn	H	H
2-212	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-213	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	Me	H
2-214	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	Me
2-215	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	F	H
2-216	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	F
2-217	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-218	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-219	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-220	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H
2-221	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
2-222	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
2-223	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
2-224	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
2-225	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
2-226	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
2-227	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
2-228	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
2-229	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H

2-230	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
2-231	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
2-232	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
2-233	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
2-234	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-235	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-236	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-237	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-238	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	Me	H
2-239	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	Me
2-240	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	F	H
2-241	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	F
2-242	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-243	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-244	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-245	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
2-246	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
2-247	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
2-248	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
2-249	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
2-250	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
2-251	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
2-252	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
2-253	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
2-254	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
2-255	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
2-256	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
2-257	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
2-258	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H

10

20

30

40

2-259	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
2-260	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-261	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-262	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-263	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-264	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-265	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-266	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-267	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-268	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-269	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-270	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-271	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-272	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-273	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-274	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-275	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-276	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-277	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-278	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
2-279	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
2-280	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
2-281	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
2-282	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-cHx	H	H
2-283	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-Ph	H	H
2-284	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-Ph	H	H
2-285	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-Ph	H	H
2-286	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> 0-Ph	H	H
2-287	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cPh	H	H

10

20

30

40

2-288	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-289	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	Me	H	
2-290	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	Me	
2-291	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	F	H	
2-292	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	F	
2-293	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-0CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	
2-294	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	10
2-295	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-296	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-F-cHx)	H	H	
2-297	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Cl-cHx)	H	H	
2-298	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Br-cHx)	H	H	
2-299	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Me-cHx)	H	H	
2-300	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Et-cHx)	H	H	
2-301	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Pr-cHx)	H	H	20
2-302	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iPr-cHx)	H	H	
2-303	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-Bu-cHx)	H	H	
2-304	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	
2-305	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-MeO-cHx)	H	H	
2-306	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-EtO-cHx)	H	H	
2-307	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-PrO-cHx)	H	H	
2-308	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-iPrO-cHx)	H	H	30
2-309	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3-MeS-cHx)	H	H	
2-310	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(4-MeS-cHx)	H	H	
2-311	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(2,4-diMe-cHx)	H	H	
2-312	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3,4-diMe-cHx)	H	H	
2-313	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-(3,5-diMe-cHx)	H	H	
2-314	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
2-315	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	Me	H	40
2-316	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	Me	

2-317	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	F	H
2-318	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	F	
2-319	H	H	Me	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
2-320	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-321	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-322	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-Ph)	H	H
2-323	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-Ph)	H	H
2-324	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-Ph)	H	H
2-325	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-Ph)	H	H
2-326	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-Ph)	H	H
2-327	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-Ph)	H	H
2-328	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-Ph)	H	H
2-329	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-Ph)	H	H
2-330	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
2-331	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-Ph)	H	H
2-332	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-Ph)	H	H
2-333	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-Ph)	H	H
2-334	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-Ph)	H	H
2-335	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-Ph)	H	H
2-336	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-337	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-338	H	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-339	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-340	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-341	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-342	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-343	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-344	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-345	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

2-346	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-347	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-348	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-349	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-350	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-351	H	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-352	H	H	Me	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-353	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-354	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-355	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-356	H	H	Me	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-357	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-358	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-359	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-360	H	H	Me	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-361	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-362	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-363	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-364	H	H	Me	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-365	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-366	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-367	H	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-368	H	H	Me	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-369	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-370	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-371	H	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-372	H	H	Me	Me	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-373	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-374	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H

10

20

30

40

2-375	H	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ]Ph	H	H	
2-376	H	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ]Ph	H	H	
2-377	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
2-378	H	H	Me	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
2-379	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
2-380	CO <sub>2</sub> Et	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
2-381	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	10
2-382	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	
2-383	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	
2-384	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-C1-Ph)	H	H	
2-385	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-C1-Ph)	H	H	
2-386	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diC1-Ph)	H	H	
2-387	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	
2-388	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	20
2-389	H	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	
2-390	H	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ]O-Ph	H	H	
2-391	H	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ]O-Ph	H	H	
2-392	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
2-393	H	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	
2-394	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	
2-395	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	30
2-396	H	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	
2-397	H	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	
2-398	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	
2-399	H	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-400	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	
2-401	H	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	
2-402	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	40
2-403	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	

2-404	H	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-405	H	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-406	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-407	H	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-408	H	H	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-409	H	H	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-410	H	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-411	H	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-412	H	H	H	H	Me	3	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-413	H	H	H	H	Me	3	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-414	H	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-415	H	H	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-416	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-417	COCH <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-418	COCH <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-419	COCH <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-420	COCH <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-421	COCH <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-422	COCH <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-423	COCH <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-424	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-425	COCH <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-426	COCH <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-427	COCH <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-428	COCH <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-429	COCH <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-430	COCH <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-431	COCH <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2-432	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H

10

20

30

40

2-433	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-434	CO <sub>2</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-435	CO <sub>2</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-436	CO <sub>2</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-437	CO <sub>2</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-438	CO <sub>2</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-439	CO <sub>2</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-440	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-441	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-442	CO <sub>2</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-443	CO <sub>2</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-444	CO <sub>2</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-445	CO <sub>2</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-446	CO <sub>2</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-447	CO <sub>2</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
2-448	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-449	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-450	CO <sub>2</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-451	CO <sub>2</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-452	CO <sub>2</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-453	CO <sub>2</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-454	CO <sub>2</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-455	CO <sub>2</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-456	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-457	CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-458	CO <sub>2</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-459	CO <sub>2</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-460	CO <sub>2</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2-461	CO <sub>2</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H

10

20

30

40

2-462	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
2-463	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	
2-464	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-465	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-466	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-467	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-468	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	10
2-469	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-470	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-471	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-472	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-473	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-474	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-475	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	20
2-476	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-477	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-478	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-479	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-480	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-481	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-482	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	30
2-483	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-484	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-485	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-486	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-487	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-cHx	H	H	
2-488	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	40
2-489	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	
2-490	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> 0-Ph	H	H	

2-491	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-492	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-493	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-494	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-495	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	
2-496	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-497	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	10
2-498	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-499	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-500	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-501	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-502	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-503	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	
2-504	COCH <sub>3</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	20
2-505	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-506	CO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-507	CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-508	CO <sub>2</sub> C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-509	CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-510	CO <sub>2</sub> C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	
2-511	CO <sub>2</sub> C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	30

上記表1 [式(I a-1)及び(I a-2)]並びに表2 [(I b-1)及び(I b-2)]において、

本発明の化合物(I)として好適には、

例示化合物番号: 1-19, 1-23~1-32, 1-36~1-45, 1-49  
 ~1-58, 1-62~1-71, 1-75~1-84, 1-88~1-102,  
 1-106~1-156, 1-160~1-214, 1-218~1-268,  
 1-272~1-322, 1-325~1-334, 1-338~1-347, 1-  
 -351~1-360, 1-364~1-373, 1-377~1-386, 1-  
 390~1-404, 1-408~1-458, 1-462~1-513, 1-5  
 17~1-526, 1-530~1-544, 1-548~1-598, 1-60  
 2~1-657, 1-670, 1-674~1-683, 1-696, 1-70  
 0~1-717, 1-721~1-730, 1-734~1-743, 1-747~  
 1-756, 1-760~1-774, 1-778~1-828, 1-832~1-  
 -886, 1-890~1-940, 1-944~1-993, 1-997~1-  
 1006, 1-1010~1-1019, 1-1045, 1-1049~1-10  
 58, 1-1062~1-1076, 1-1080~1-1130, 1-1134  
 ~1-1185, 1-1189~1-1198, 1-1202~1-1208, 1-  
 -1212~1-1216, 1-1220~1-1270, 1-1274~1-13 50

3 1, 1 - 1 3 3 5 ~ 1 - 1 3 4 4, 1 - 1 3 4 8 ~ 1 - 1 3 5 7, 1 - 1 3 6 1  
 ~ 1 - 1 3 7 0, 1 - 1 3 7 4 ~ 1 - 1 3 8 7, 1 - 1 3 9 1 ~ 1 - 1 4 0 0, 1  
 - 1 4 0 4 ~ 1 - 1 4 1 8, 1 - 1 4 2 2 ~ 1 - 1 4 7 2, 1 - 1 4 7 6 ~ 1 - 1 5  
 2 7, 1 - 1 5 3 1 ~ 1 - 1 5 4 0, 1 - 1 5 4 4 ~ 1 - 1 5 5 8, 1 - 1 5 6 2  
 ~ 1 - 1 6 1 2, 1 - 1 6 1 6 ~ 1 - 1 6 7 3, 1 - 1 6 7 7 ~ 1 - 1 6 8 6, 1  
 - 1 6 9 0 ~ 1 - 1 6 9 9, 1 - 1 7 0 3 ~ 1 - 1 7 1 2, 1 - 1 7 1 6 ~ 1 - 1 7  
 2 9, 1 - 1 7 3 3 ~ 1 - 1 7 4 4, 1 - 1 7 4 8 ~ 1 - 1 7 6 7, 1 - 1 7 7 2  
 ~ 1 - 1 7 9 3, 1 - 1 7 9 7 ~ 1 - 1 8 1 8, 1 - 1 8 2 4 ~ 1 - 1 8 4 6, 1  
 - 1 8 5 0 ~ 1 - 1 8 6 9, 1 - 1 8 7 2, 1 - 1 8 7 6, 1 - 1 8 8 0, 1 -  
 1 8 8 4, 1 - 1 8 8 8 ~ 1 - 1 8 9 2, 1 - 1 8 9 6, 1 - 1 9 0 0, 1 - 1 10  
 9 0 8 ~ 1 - 1 9 1 3, 1 - 1 9 1 7 ~ 1 - 1 9 3 9, 1 - 1 9 4 3 ~ 1 - 1 9 6 6  
 , 1 - 1 9 7 0 ~ 1 - 1 9 9 1, 1 - 1 9 9 5 ~ 1 - 2 0 1 3, 1 - 2 0 1 7,  
 1 - 2 0 2 1, 1 - 2 0 2 5, 1 - 2 0 2 9, 1 - 2 0 3 3, 1 - 2 0 3 7 ~  
 1 - 2 0 4 2, 1 - 2 0 4 5 ~ 1 - 2 0 6 8, 1 - 2 0 7 2 ~ 1 - 2 0 8 9, 1 - 2  
 0 9 3, 1 - 2 0 9 7, 1 - 2 1 0 1, 1 - 2 1 0 5, 1 - 2 1 0 9, 1 - 2  
 1 1 3, 1 - 2 1 1 7, 1 - 2 1 2 1, 1 - 2 1 2 5, 1 - 2 1 2 9, 1 - 2 1  
 3 3, 1 - 2 1 3 5, 1 - 2 1 3 9 ~ 1 - 2 1 5 8, 1 - 2 1 6 1 ~ 1 - 2 1 6 4  
 , 1 - 2 1 8 4 ~ 1 - 2 3 4 6, 1 - 2 3 9 8 ~ 1 - 2 5 5 7,  
 2 - 9 ~ 2 - 1 8, 2 - 2 2 ~ 2 - 4 3, 2 - 4 7 ~ 2 - 7 0, 2 - 7 4 ~ 2 - 9  
 6, 2 - 1 0 0 ~ 2 - 1 1 9, 2 - 1 4 2, 2 - 1 4 6, 2 - 1 5 0, 2 - 1 20  
 5 4, 2 - 1 5 8 ~ 2 - 1 6 3, 2 - 1 6 7 ~ 2 - 1 8 3, 2 - 1 8 5 ~ 2 - 1 8  
 9, 2 - 1 9 3 ~ 2 - 2 1 6, 2 - 2 2 0 ~ 2 - 2 4 1, 2 - 2 4 5 ~ 2 - 2 6 3,  
 2 - 2 6 7, 2 - 2 7 1, 2 - 2 7 5, 2 - 2 7 9, 2 - 2 8 3, 2 - 2 8  
 7 ~ 2 - 2 9 2, 2 - 2 9 6 ~ 2 - 3 1 8, 2 - 3 2 2 ~ 2 - 3 3 8, 2 - 3 4 3  
 , 2 - 3 4 7, 2 - 3 5 1, 2 - 3 7 1, 2 - 3 7 5 ~ 2 - 3 7 7, 2 - 3 8  
 1 ~ 2 - 4 0 7, 2 - 4 1 6 ~ 2 - 5 1 1,

であり、更に好適には、

1 - 1 9, 1 - 3 2, 1 - 3 6 ~ 1 - 4 5, 1 - 5 7, 1 - 6 2 ~ 1 - 7 1,  
 1 - 8 4, 1 - 8 8, 1 - 9 7 ~ 1 - 1 0 0, 1 - 1 5 2 ~ 1 - 1 5 4, 1 - 1  
 6 0 ~ 1 - 2 1 4, 1 - 2 1 8 ~ 1 - 2 2 7, 1 - 2 6 4 ~ 1 - 2 6 8, 1 - 2 7 30  
 2 ~ 1 - 3 2 2, 1 - 3 3 4, 1 - 3 4 7, 1 - 3 6 0, 1 - 3 7 3, 1 - 3  
 8 6, 1 - 3 9 0 ~ 1 - 4 0 2, 1 - 4 5 4 ~ 1 - 4 5 8, 1 - 4 6 2 ~ 1 - 5 1  
 3, 1 - 5 2 6, 1 - 5 3 0 ~ 1 - 5 4 2, 1 - 5 9 4 ~ 1 - 5 9 8, 1 - 6 0  
 2 ~ 1 - 6 5 3, 1 - 7 4 3, 1 - 7 5 6, 1 - 7 6 0 ~ 1 - 7 6 8, 1 - 7 7  
 0 ~ 1 - 7 7 4, 1 - 7 7 8 ~ 1 - 8 2 8, 1 - 8 3 2 ~ 1 - 8 8 6, 1 - 8 9 0  
 ~ 1 - 9 4 0, 1 - 9 4 4 ~ 1 - 9 9 3, 1 - 1 0 4 5, 1 - 1 0 5 8, 1 - 1 0  
 6 2 ~ 1 - 1 0 7 4, 1 - 1 1 2 6 ~ 1 - 1 1 3 0, 1 - 1 1 3 4 ~ 1 - 1 1 8 5,  
 1 - 1 1 9 8, 1 - 1 2 0 2 ~ 1 - 1 2 0 8, 1 - 1 2 1 2, 1 - 1 2 1 3, 1  
 - 1 2 1 4, 1 - 1 2 6 6 ~ 1 - 1 2 7 0, 1 - 1 2 7 4 ~ 1 - 1 3 3 1, 1 - 1 3  
 4 4, 1 - 1 3 4 8 ~ 1 - 1 3 5 7, 1 - 1 3 7 0, 1 - 1 3 7 4 ~ 1 - 1 3 8 7 40  
 , 1 - 1 4 0 0, 1 - 1 4 0 4 ~ 1 - 1 4 1 6, 1 - 1 4 6 8 ~ 1 - 1 4 7 2, 1  
 - 1 4 7 6 ~ 1 - 1 5 2 7, 1 - 1 5 4 0, 1 - 1 5 4 4 ~ 1 - 1 5 5 6, 1 - 1  
 6 0 8 ~ 1 - 1 6 1 2, 1 - 1 6 1 6 ~ 1 - 1 6 6 6, 1 - 1 7 2 9, 1 - 1 7 4 2  
 , 1 - 1 7 4 4, 1 - 1 7 5 9 ~ 1 - 1 7 6 7, 1 - 1 7 8 9 ~ 1 - 1 7 9 3, 1  
 - 1 7 9 7 ~ 1 - 1 8 1 8, 1 - 1 8 4 2 ~ 1 - 1 8 4 6, 1 - 1 9 0 0, 1 - 1  
 9 0 8 ~ 1 - 1 9 1 3, 1 - 1 9 3 5 ~ 1 - 1 9 3 9, 1 - 1 9 4 3 ~ 1 - 1 9 6 6,  
 1 - 1 9 8 7 ~ 1 - 1 9 9 1, 1 - 2 0 1 3, 1 - 2 0 1 7, 1 - 2 0 2 9,  
 1 - 2 0 3 3, 1 - 2 0 3 7 ~ 1 - 2 0 4 2, 1 - 2 0 6 4 ~ 1 - 2 0 6 8, 1 -  
 2 0 7 2 ~ 1 - 2 0 8 9, 1 - 2 0 9 3, 1 - 2 0 9 7, 1 - 2 1 0 1, 1 - 2  
 1 0 5, 1 - 2 1 0 9, 1 - 2 1 2 9, 1 - 2 1 3 3, 1 - 2 1 3 5, 1 - 2 50

1 8 4 ~ 1 - 2 3 4 6 , 1 - 2 3 9 8 ~ 1 - 2 5 5 7 , 2 - 1 1 ~ 2 - 1 8 , 2 - 3  
 9 ~ 2 - 4 3 , 2 - 4 7 ~ 2 - 7 0 , 2 - 1 8 5 ~ 2 - 1 8 9 , 2 - 1 9 3 ~ 2 -  
 2 1 6 , 2 - 2 8 7 ~ 2 - 2 9 2 , 2 - 3 3 8 , 2 - 3 4 3 , 2 - 3 4 7 , 2  
 - 3 5 1 , 2 - 4 1 6 ~ 2 - 5 1 1 ,

であり、より好適には、

1 - 4 5 , 1 - 7 1 , 1 - 8 4 , 1 - 8 8 , 1 - 9 7 ~ 1 - 1 0 0 , 1 - 1 5  
 2 ~ 1 - 1 5 4 , 1 - 1 6 0 ~ 1 - 2 0 6 , 1 - 2 0 9 ~ 1 - 2 1 2 , 1 - 2 6 4  
 ~ 1 - 2 6 6 , 1 - 3 3 4 , 1 - 3 7 3 , 1 - 3 8 6 , 1 - 3 9 0 ~ 1 - 4 0 2  
 , 1 - 4 5 4 ~ 1 - 4 5 8 , 1 - 4 6 2 ~ 1 - 4 8 5 , 1 - 5 0 9 , 1 - 5 1 0  
 , 1 - 5 1 3 , 1 - 5 2 6 , 1 - 5 3 0 ~ 1 - 5 4 2 , 1 - 5 9 4 ~ 1 - 5 9 8 10  
 , 1 - 6 0 2 ~ 1 - 6 1 3 , 1 - 6 4 9 , 1 - 6 5 0 , 1 - 7 4 3 , 1 - 7 5  
 6 , 1 - 7 6 0 ~ 1 - 7 6 8 , 1 - 7 7 0 ~ 1 - 7 7 2 , 1 - 8 2 4 ~ 1 - 8 2 8  
 , 1 - 8 3 2 ~ 1 - 8 8 4 , 1 - 9 3 6 , 1 - 1 0 4 5 , 1 - 1 0 5 8 , 1 -  
 1 0 6 2 ~ 1 - 1 0 7 4 , 1 - 1 1 2 6 ~ 1 - 1 1 3 0 , 1 - 1 1 3 4 ~ 1 - 1 1 4  
 5 , 1 - 1 1 4 8 ~ 1 - 1 1 5 1 , 1 - 1 1 6 2 , 1 - 1 1 6 3 , 1 - 1 1 7 9  
 ~ 1 - 1 1 8 2 , 1 - 1 1 8 5 , 1 - 1 1 9 8 , 1 - 1 2 0 2 ~ 1 - 1 2 0 8 ,  
 1 - 1 2 1 2 , 1 - 1 2 1 3 , 1 - 1 2 1 4 , 1 - 1 2 6 6 ~ 1 - 1 2 7 0 , 1  
 - 1 2 7 4 ~ 1 - 1 2 8 5 , 1 - 1 2 8 8 ~ 1 - 1 2 9 1 , 1 - 1 3 1 9 ~ 1 - 1 3  
 2 2 , 1 - 1 3 2 9 ~ 1 - 1 3 3 1 , 1 - 1 3 4 4 , 1 - 1 3 4 8 ~ 1 - 1 3 5 7  
 , 1 - 1 3 7 0 , 1 - 1 3 8 7 , 1 - 1 4 0 0 , 1 - 1 4 0 4 ~ 1 - 1 4 1 6 , 20  
 1 - 1 4 6 8 ~ 1 - 1 4 7 2 , 1 - 1 4 7 6 ~ 1 - 1 4 8 7 , 1 - 1 4 9 0 ~ 1 -  
 1 4 9 3 , 1 - 1 5 0 4 , 1 - 1 5 0 5 , 1 - 1 5 2 1 ~ 1 - 1 5 2 4 , 1 - 1  
 5 2 7 , 1 - 1 5 4 0 , 1 - 1 5 4 4 ~ 1 - 1 5 5 6 , 1 - 1 6 0 8 ~ 1 - 1 6 1  
 2 , 1 - 1 6 1 6 ~ 1 - 1 6 2 7 , 1 - 1 6 6 3 , 1 - 1 6 6 4 , 1 - 1 7 2 9  
 , 1 - 1 7 4 2 , 1 - 1 7 4 4 , 1 - 1 7 6 1 ~ 1 - 1 7 6 6 , 1 - 1 7 8 9 ~  
 1 - 1 7 9 1 , 1 - 1 8 1 5 ~ 1 - 1 8 1 8 , 1 - 1 9 0 0 , 1 - 1 9 0 9 , 1  
 - 1 9 6 2 , 1 - 2 0 6 4 ~ 1 - 2 0 6 6 , 1 - 2 0 8 9 , 1 - 2 0 9 3 , 1 -  
 2 0 9 7 , 1 - 2 1 0 5 , 1 - 2 1 3 3 , 1 - 2 2 1 6 ~ 1 - 2 2 8 8 , 1 - 2  
 2 9 0 ~ 1 - 2 3 4 6 , 1 - 2 3 9 8 ~ 1 - 2 5 5 7 ,

であり、更により好適な化合物は、

30

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 7 1 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル

- 4 - [ 5 - ( 4 - シクロヘキシルブチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 8 4 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル

- 4 - [ 5 - ( 4 - フェニルブチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 9 8 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル

- 4 - [ 5 - ( 5 - シクロヘキシルペンチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル

、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 5 2 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

ル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 2 1 0 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

ル - 4 - [ 5 - ( 6 - シクロヘキシルヘキシル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステ

ル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 2 6 4 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

ル - 4 - [ 5 - ( 6 - フェニルヘキシル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 3 7 3 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

ル - 4 - [ 5 - ( 3 - シクロヘキシルオキシプロピル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル

エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 3 8 6 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

ル - 4 - [ 5 - ( 3 - フェノキシプロピル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 4 0 0 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチ

40

50

ルー4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-454:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェノキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-509:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-510:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェノキシペンチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-513:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシプロピル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-743:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-756:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-770:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-824:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-882:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシ-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-936:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-フェニルヘキシ-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1045:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロピニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1058:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フェノキシプロピニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1072:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1126:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェノキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1181:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルオキシペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1182:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェノキシペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1185:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロピニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

10

20

30

40

50

チル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1329 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1330 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1331 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1344 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1357 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1370 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-フェニルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1387 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-

4-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1400 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フェノキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1414 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1468 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェノキシブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1523 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1524 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェノキシペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1527 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1729 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1742 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルエトキシフェニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1744 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシフェニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1761 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-エ

10

20

30

40

50

チル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1764:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1816:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1900:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

10

例示化合物番号 式Ia-1における1-1909:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1962:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシ-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2089:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

20

例示化合物番号 式Ia-1における1-2097:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、及び

例示化合物番号 式Ia-1における1-2105:リン酸モノ2-アミノ-2-エチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、並びに

例示化合物番号 式Ia-1における1-463:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-479:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

30

例示化合物番号 式Ia-1における1-594:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-760:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-761:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

40

例示化合物番号 式Ia-1における1-762:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-エチルフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-763:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-764:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

50

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-765 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-エトキシフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-766 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルチオフェニル)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-832 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-833 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、10

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-834 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-クロロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-836 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-メチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-837 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、20

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-846 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-847 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-トリフルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-848 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、30

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-849 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-860 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-メチルチオフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-861 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-877 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、40

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-878 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1050 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-(4-メチルシクロヘキシルオキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1062 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-(4-フルオロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル 50

] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1063 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1064 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エチルフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1065 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

10

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1066 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メトキシフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1067 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エトキシフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1068 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルチオフェノキシ) プロピニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

20

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1134 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-フルオロフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1135 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1136 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-クロロフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1138 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メチルフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

30

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1139 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1148 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1149 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

40

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1150 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メトキシフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1151 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1162 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メチルチオフェノキシ) プト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1163 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メ

50

チル-4-[5-[4-(4-メチルチオフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1179:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4-ジメチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1180:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,5-ジメチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1198:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フェニルメトキシプロピニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1202:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-フルオロフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1203:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1204:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エチルフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1205:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1206:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メトキシフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1207:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エトキシフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1208:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-メチルチオフェニル)メトキシプロピニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1212:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1266:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルメトキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1274:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フルオロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1275:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フルオロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1276:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-クロロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-1278:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-メチルフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 7 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (4-メチルフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチルエステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 8 8 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (3-トリフルオロメチルフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 8 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 9 0 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (3-メトキシフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、 10

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 9 1 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (4-メトキシフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 1 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (3, 4-ジメチルフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 2 0 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (3, 5-ジメチルフェニル) メトキシブト-1-イニル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、 20

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 4 8 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-フルオロフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 4 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-メチルフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 5 0 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-エチルフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、 30

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 5 1 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 5 2 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-メトキシフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 5 3 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-エトキシフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 5 4 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [5- (4-メチルチオフェニル) ペンタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、 40

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 4 7 6 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (3-フルオロフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 4 7 7 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (4-フルオロフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 4 7 8 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4- [5- [4- (4-クロロフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] 50

ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1480 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1481 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1490 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

10

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1491 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1492 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メトキシフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1493 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1504 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-メチルチオフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

20

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1505 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-メチルチオフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1521 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3, 4-ジメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1522 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3, 5-ジメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

30

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2093 : リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル) チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2101 : リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2109 : リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(6-フェニルヘキサノイル) チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2257 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3, 4-ジフルオロフェニル) ペント-1-イニル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

40

エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2258 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3, 5-ジフルオロフェニル) ペント-1-イニル] チオフェン-2-イル] ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2259 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-クロロフェニル) ペント-1-イニル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2260 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3, 4-ジクロロフェニル) ペント-1-イニル] チオフェン-2-イル] ブチル エステル、

50

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2261 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2262 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジトリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2263 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2264 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジメトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2265 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジメトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2266 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4,5-トリメトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2267 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-アセチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2268 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-アセチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2269 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フルオロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2270 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3,4-ジフルオロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2271 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3,5-ジフルオロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2272 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-クロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2273 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-クロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2274 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3,4-ジクロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2275 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3,5-ジクロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2276 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-メチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2278 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

10

20

30

40

50

イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2279 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,5-ジメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2280 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2281 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジトリフルオロメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

10

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2282 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2283 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2284 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

20

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2285 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2286 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2287 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2288 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

30

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2290 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2291 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,5-ジフルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2292 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-クロロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

40

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2293 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4-ジクロロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2294 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,5-ジクロロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2295 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル] プチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2296 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メ

50

チル-4-[5-[4-(3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2297:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4-ジメトキシフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2298:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,5-ジメトキシフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2299:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

10

例示化合物番号 式Ia-1における1-2300:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(3-アセチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2301:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[4-(4-アセチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2328:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

20

例示化合物番号 式Ia-1における1-2329:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2330:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2331:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2332:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

30

例示化合物番号 式Ia-1における1-2333:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2334:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2335:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-メチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

40

例示化合物番号 式Ia-1における1-2336:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2337:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式Ia-1における1-2338:リン酸モノ2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

50

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2339 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2340 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2341 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-メトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2342 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、 10

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2343 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,5-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2344 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3,4,5-トリメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2345 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(3-アセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、 20

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2346 : リン酸モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-アセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチルエステル、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-71 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-84 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-98 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、 30

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-152 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-210 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-264 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-フェニルヘキシル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-373 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-386 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-フェノキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、 40

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-400 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-454 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェノキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-509 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-510 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェノキシペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-513 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルメトキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、 50

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 2 9 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 3 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - フェニルブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 3 1 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 4 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - フェニルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 5 7 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (6 - シクロヘキシルヘキサノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、 10

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 7 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (6 - フェニルヘキサノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 8 7 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (3 - シクロヘキシルオキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 4 0 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (3 - フェノキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 4 1 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルオキシブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、 20

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 4 6 8 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - フェノキシブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 5 2 3 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルオキシペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 5 2 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - フェノキシペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 5 2 7 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルメトキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、 30

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 2 9 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルメトキシフェニル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 4 2 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルエトキシフェニル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 4 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - ベンジルオキシフェニル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 6 1 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルブチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、 40

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 6 4 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペンチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 8 1 6 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (6 - シクロヘキシルヘキシル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 0 8 9 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 0 9 7 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、及び

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 1 0 5 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 50

-(6-シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、並びに

例示化合物番号 式Ia-2における1-463:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

例示化合物番号 式Ia-2における1-479:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

例示化合物番号 式Ia-2における1-594:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-ベンジルオキシブチル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
10

例示化合物番号 式Ia-2における1-1348:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1349:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-メチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1350:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-エチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1351:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペ  
ンチルホスホン酸、  
20

例示化合物番号 式Ia-2における1-1352:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-メトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1353:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-エトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1354:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-メチルチオフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホ  
スホン酸、  
30

例示化合物番号 式Ia-2における1-1476:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(3-フルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1477:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1478:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-クロロフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
40

例示化合物番号 式Ia-2における1-1480:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(3-メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1481:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1490:3-アミノ-3-メチル-5-[5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル]ペ  
ンチルホスホン酸、  
50

例示化合物番号 式Ia-2における1-1491:3-アミノ-3-メチル-5-[5-

－ [4－(4－トリフルオロメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1492 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(3－メトキシフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1493 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(4－メトキシフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1504 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(3－メチルチオフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

10

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1505 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(4－メチルチオフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1521 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(3, 4－ジメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－1522 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[4－(3, 5－ジメチルフェノキシ) ブタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

20

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2093 : 3－アミノ－エチル－5－[5－(4－フェニルブタノイル) チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2101 : 3－アミノ－エチル－5－[5－(5－フェニルペンタノイル) チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2109 : 3－アミノ－エチル－5－[5－(6－フェニルヘキサノイル) チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2328 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3－フルオロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2329 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3, 4－ジフルオロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

30

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2330 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3, 5－ジフルオロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2331 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3－クロロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2332 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(4－クロロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

40

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2333 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3, 4－ジクロロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2334 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3, 5－ジクロロフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a－2 における 1－2335 : 3－アミノ－3－メチル－5－[5－[5－(3－メチルフェニル) ペンタノイル] チオフェン－2－イル] ペンチルホスホン酸、

50

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 3 6 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 3 7 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 5 - ジメチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 3 8 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 - トリフルオロメチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 3 9 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 4 - ジトリフルオロメチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 5 - ジトリフルオロメチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 1 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 - メトキシフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 2 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 3 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 5 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 3 - アセチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸及び

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 3 4 6 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - ( 4 - アセチルフェニル ) ペンタノイル ] チオフェン - 2 - イル ] ペンチルホスホン酸

であり、最も好適には、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 7 1 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - シクロヘキシルブチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 9 8 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - シクロヘキシルペンチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 5 2 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 4 0 0 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - シクロヘキシルオキシブチル ) チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 4 6 3 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) ブチル ] チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 4 7 9 : リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - メトキシフェノキシ ) ブチル ] チオフェン - 2 - イル ] ブチル エステル、

10

20

30

40

50

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 5 9 4 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 7 4 3 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 7 5 6 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 7 7 0 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 8 2 4 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 8 3 3 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 8 4 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 0 5 0 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルシクロヘキシルオキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 0 6 3 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 0 6 4 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 0 6 8 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 0 7 2 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 1 3 5 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 1 3 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 1 8 5 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロピニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 2 6 6 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルメトキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a - 1 における 1 - 1 3 2 9 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エ

10

20

30

40

50

ステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1330 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1331 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1344 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1348 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1764 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-1909 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2097 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2273 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2276 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2278 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2283 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2284 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2285 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2287 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-1 における 1-2288 : リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロピニル]チオフェン-2-イル]ブチル エステル、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-71 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a-2 における 1-98 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

10

20

30

40

50

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 5 2 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - フェニルペンチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 4 0 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルオキシブチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 4 6 3 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 4 - (4 - フルオロフェノキシ) ブチル] チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

、  
例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 4 7 9 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 4 - (4 - メトキシフェノキシ) ブチル] チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

、  
例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 5 9 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - ベンジルオキシブチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 2 9 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - シクロヘキシルブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 3 0 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (4 - フェニルブタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 3 1 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 4 4 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - (5 - フェニルペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 3 4 8 : 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [ 5 - [ 5 - (4 - フルオロフェニル) ペンタノイル] チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 1 7 6 4 : 3 - アミノ - 3 - エチル - 5 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペンチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

及び

例示化合物番号 式 I a - 2 における 1 - 2 0 9 7 : 2 - アミノ - 2 - エチル - 4 - [ 5 - (5 - シクロヘキシルペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

である。

【0065】

30

【発明の実施の形態】

本発明の化合物 (I) は、以下に記載する方法に従って製造することができる。

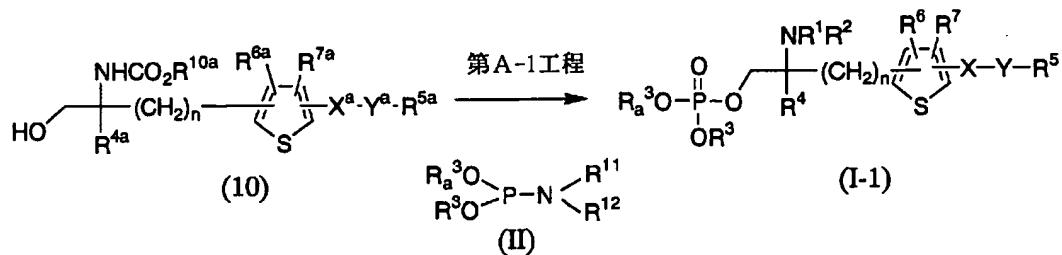
【0066】

A 法は、化合物 (I) において、Z が酸素原子である化合物 (I-1) を製造する方法である。

【0067】

【化9】

A法



【0068】

上記式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>a</sup><sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X、Y 及び n は、前述したものと同意義を示す。R<sup>10a</sup> は、低級アルキル基 (特に、t-ブチル基) 又は低級

50

アルコキシ基（特に、*t*-ブロキシ基）を示し、R<sup>4a</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7a</sup>、X<sup>a</sup>及びY<sup>a</sup>は、各々、R<sup>4a</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7a</sup>、X<sup>a</sup>及びY<sup>a</sup>に含まれるアミノ、ヒドロキシ及び/又はカルボキシル基が、保護されてもよいアミノ、ヒドロキシ及び/又はカルボキシル基である他、それぞれ、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X及びYの基の定義におけるものと同意義を示し、R<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>は、同一又は異なって、低級アルキル基（特に、エチルまたはイソプロピル基）を示す。

## 【0069】

上記において、R<sup>5a</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7a</sup>、X<sup>a</sup>及びY<sup>a</sup>の定義における「保護されてもよいアミノ基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるアミノ基の保護基であれば特に限定はされないが、例えば、

10

前記「低級脂肪族アシル基」、クロロアセチル、トリフルオロアセチルのようなハロゲノ低級脂肪族アシル基、メトキシアセチルのような低級アルコキシで置換された低級脂肪族アシル基などの「低級脂肪族アシル類」；

a

ベンゾイル、1-インダンカルボニル、1-若しくは2-ナフトイルのような芳香族アシル基、4-クロロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2, 4, 6-トリメチルベンゾイルのような前記置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基などの「芳香族アシル類」；

前記「低級アルコキカルボニル基」、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、2-トリメチルシリルエトキシカルボニルのようなハロゲンまたはトリ低級アルキルシリルで置換された低級アルコキカルボニル基などの「低級アルコキカルボニル基」；  
ビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニルのような「低級アルケニルオキシカルボニル基」；

20

ベンジルオキシカルボニルのようなアラルキルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル、3, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル、2-ニトロベンジルオキシカルボニルのような前記置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基などの「アラルキルオキシカルボニル類」；

トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジメチルシリル、*t*-ブチルジメチルシリルのようなトリ低級アルキルシリル基、ジフェニルメチルシリル、フェニルジイソプロピルシリルのようなアリールまたはアリールと低級アルキルとでトリ置換されたシリル基などの「シリル類」；

30

ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、 $\alpha$ -ナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチルのような1~3個のアリール基で置換された低級アルキル基、4-メチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、4-メトキシベンジル、4-メトキシフェニルジフェニルメチル、2-ニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-ブロモベンジル、4-シアノベンジル、4-シアノベンジルジフェニルメチル、ビス(2-ニトロフェニル)メチル、ピペロニルのような低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ハロまたはシアノでアリール環が置換された1乃至3個のアリール基で置換された低級アルキル基などの「アラルキル類」；又は

N, N-ジメチルアミノメチレン、ベンジリデン、4-メトキシベンジリデン、4-ニトロベンジリデン、サリシリデン、5-クロロサリシリデン、ジフェニルメチレン、(5-クロロ-2-ヒドロキシフェニル)フェニルメチレンのような「シップ塩基を形成する置換されたメチレン基」であり得、好適には、低級アルコキカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基であり、好適には、低級アルコキカルボニル基又は低級アルケニルオキシカルボニル基であり、最も好適には*t*-ブロキシカルボニル基又はアリルオキシカルボニル基である。

a

## 【0070】

上記において、R<sup>4a</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7a</sup>、X<sup>a</sup>及びY<sup>a</sup>の定義における「保護されてもよいヒドロキシ基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるヒドロキシ基の保護基であれば特に限定はされないが、例えば、

50

前記「低級脂肪族アシル類」；

前記「芳香族アシル類」；

テトラヒドロピラン-2-イル、3-プロモテトラヒドロピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロピラン-4-イル、テトラヒドロチオピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロチオピラン-4-イルのような「テトラヒドロピラニル又はテトラヒドロチオピラニル類」；

テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロチオフラン-2-イルのような「テトラヒドロフラニル又はテトラヒドロチオフラニル類」；

前記「シリル類」；

メトキシメチル、1,1-ジメチル-1-メトキシメチル、エトキシメチルのような低級アルコキシメチル基、2-メトキシエトキシメチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシメチル基、2,2,2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲノ低級アルコキシメチル等の「低級アルコキシメチル類」；  
1-エトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチルのような低級アルコキシ化エチル基、2,2,2-トリクロロエチルのようなハロゲン化エチル基等の「置換エチル類」；

前記「アラルキル類」；

前記「低級アルコキカルボニル類」；

前記「低級アルケニルオキシカルボニル類」；又は

前記「アラルキルオキシカルボニル類」

であり得、好適には、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、低級アルコキシカルボニル基又は(低級アルコキシ)メチル基であり、更に好適には、低級脂肪族アシル基又は(低級アルコキシ)メチル基であり、最も好適にはアセチル基又はメトキシメチル基である。

#### 【0071】

上記において、 $R^{5a}$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{7a}$ 、 $X^a$ 及び $Y^a$ の定義における「保護されてもよいカルボキシル基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるカルボキシル基の保護基であれば特に限定はされないが、例えば、前記「低級アルキル基」；又は前記「アラルキル基」であり得、好適には低級アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

#### 【0072】

第A-1工程は、一般式(I-1)を有する化合物を製造する工程であり、アルコール体(10)と化合物(I I)とを反応させて亜リン酸エステル体とし、次いで、酸化剤と反応させ、所望により、式 $C O_2 R^{10a}$ を有する基を含むアミノ基の保護基を除去し、ヒドロキシの保護基を除去し、カルボキシル基の保護基を除去し、リン酸基の保護基を除去し及び/又はアミノ基を低級脂肪族アシル化又は低級アルコキシカルボニル化(アシル化)することにより行われる。

#### 【0073】

所望の反応は、適宜順序を変えて行うことでき、保護基の除去は、適宜反応条件を選択して、選択的に除去することができる。

#### 【0074】

一級水酸基を有する化合物をリン酸エステル体に導くには、有機合成化学の分野で一般的に使用される方法に準じて行うことができる。例えば、実験化学講座22(第4版:丸善)「有機合成IV」第3章「リン酸エステル」に記載の方法により、容易に導くことが可能である。実際には以下のようないわゆる方法が好適である。

#### 【0075】

すなわち、アルコール体(10)と化合物(I I)とを、不活性溶媒中、活性化剤存在下、反応させ亜リン酸エステル体を製造し、次いで、不活性溶媒中、酸化剤と反応させる方法である。

#### 【0076】

化合物(10)と化合物(I I)との反応において使用される不活性溶媒は、例えば、ヘ

10

20

30

40

50

キサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類或は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類又はエーテル類（最も好適には、塩化メチレン又はテトラヒドロフラン）である。

## 【0077】

使用される活性化剤は、例えば、1H-テトラゾール、5-メチル-1H-テトラゾール、5-フェニル-1H-テトラゾールのようなテトラゾール類、（好適には、1H-テトラゾール）である。

10

## 【0078】

使用される化合物（I I）は、好適には、ジアリル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジメチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジエチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジベンジル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジ-t-ブチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジベンジル N, N-ジエチルホスホロアミダイト、ジ-t-ブチル N, N-エチルホスホロアミダイト、ジベンジル N, N-ジエチルホスホロアミダイト、N, N-ジエチル-1, 5-ジヒドロ-2, 4, 3-ベンゾジオキサホスフェピン-3-アミン、ビス（2-シアノエチル） N, N-ジイソプロピルホルホロアミダイト又はビス（9-フルオレニルメチル） N, N-ジイソプロピルホルホロアミダイトのようなホスホロアミダイト類であり、特に 20 好適には、ジアリル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイトである。

## 【0079】

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-10℃乃至60℃（好適には0℃乃至30℃）である。

## 【0080】

反応時間は、原料化合物、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分間乃至24時間（好適に30分間乃至2時間）である。

30

## 【0081】

上記反応で得られる亜リン酸エステル体は、反応の後処理及び単離をせずに、酸化剤と反応することができる。

## 【0082】

酸化剤との反応において使用される不活性溶媒は、アルコール体（10）と化合物（I I）との反応に使用されるものと同様のものである。

## 【0083】

使用される酸化剤は、例えば、t-ブチルヒドロペルオキシド、クメンヒドロペルオキシド、m-クロロ過安息香酸、3, 5-ジニトロ過安息香酸、0-カルボキシ過安息香酸、ジメチルオキソラン、過酢酸、過トリフルオロ酢酸、過フタル酸、過酸化水素水のような過酸化物であり、好適には、t-ブチルヒドロペルオキシド又はm-クロロ過安息香酸である。

40

## 【0084】

反応温度は、得られた亜リン酸エステル体、酸化剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-78℃乃至室温（好適には、-78℃乃至0℃）である。

## 【0085】

反応時間は、得られた亜リン酸エステル体、酸化剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分間乃至2時間（好適には、5分間乃至30分間）である。

## 【0086】

アミノ、ヒドロキシ及びカルボキシル基の保護基の除去はその種類によって異なるが、一般に有機合成化学の技術において周知の方法、例えば、T. W. Green, (Protective Groups in Organic Synthesis), John Wiley & Sons; J. F. W. McOmisch, (Protective

50

Groups in Organic Chemistry), Plenum Pressに記載の方法により以下のように行うことができる。

【0087】

アミノ基の保護基が、シリル類である場合には、通常、弗化テトラブチルアンモニウム、弗化水素酸、弗化水素酸-ピリジン、弗化カリウムのような弗素アニオンを生成する化合物で処理するか、又は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸のような無機酸又は酢酸、蟻酸、蔥酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸（好適には、塩酸）で処理することにより除去できる。

【0088】

尚、弗素アニオンにより除去する場合に、蟻酸、酢酸、プロピオン酸のような有機酸を加えることによって、反応が促進することがある。

【0089】

上記反応に使用される溶媒は、好適には、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類；酢酸のような有機酸；水；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、テトラヒドロフランである。

【0090】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、反応温度は、0℃乃至100℃（好適には、10℃乃至50℃）であり、反応時間は、10分間乃至24時間（好適には、30分間乃至6時間）である。

【0091】

アミノ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキオキシカルボニル類である場合には、通常、不活性溶媒中、還元剤と接触させること（好適には、触媒下、常温にて水素を用いる接触還元）により除去する方法又は酸化剤を用いて除去する方法が好適である。

【0092】

接触還元による除去に使用される溶媒は、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンオール、メチルセロソルブのようなアルコール類；酢酸のような有機酸類；水；又は上記溶媒と水との混合溶媒であり、好適には、アルコール類、エーテル類、有機酸類又は水（最も好適には、アルコール類又は有機酸類）である。

【0093】

接触還元による除去に使用される触媒は、通常、接触還元反応に使用されるものであれば、特に限定はないが、好適には、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム、パラジウム-硫酸バリウムである。

【0094】

水素の圧力は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧である。

【0095】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、反応温度は、0℃乃至100℃であり、反応時間は、5分間乃至24時間である。

【0096】

酸化剤を用いる除去において使用される溶媒は、本反応に関与しないものであれば特に限 50

定はないが、好適には、含水有機溶媒であり、このような有機溶媒は、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトンのようなケトン類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；又はスルホランであり、好適には、ハロゲン化炭化水素類、エーテル類又はスルホキシド類（最も好適には、ハロゲン化炭化水素類又はスルホキシド類）である。

【0097】

10

使用される酸化剤は、酸化に使用される化合物であれば特に限定はないが、好適には、過硫酸カリウム、過硫酸ナトリウム、アンモニウムセリウムナイトレイト（C A N）、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノ-p-ベンゾキノン（D D Q）である。

【0098】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、反応温度は、0℃乃至150℃であり、反応時間は、10分間乃至24時間である。

【0099】

また、アミノ基の保護基が、アラルキル類である場合には、不活性溶媒中、酸を用いて保護基を除去することもできる。

【0100】

20

上記反応に使用される酸は、通常の反応において酸触媒として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸のような無機酸；酢酸、蟻酸、蔴酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸等のブレンステッド酸；塩化亜鉛、四塩化スズ、ボロントリクロリド、ボロントリフルオリド、ボロントリブロミドのようなルイス酸；又は酸性イオン交換樹脂であり、好適には、無機酸又は有機酸（最も好適には、塩酸、酢酸又はトリフルオロ酢酸）である。

【0101】

30

使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；又は水又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、エーテル類、アルコール類又は水（最も好適には、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エタノール又は水）である。

40

【0102】

反応温度は、原料化合物、使用される酸、溶媒等により異なるが、通常、-20℃乃至沸点温度（好適には、0℃乃至100℃）である。

【0103】

反応時間は、原料化合物、使用される酸、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至48時間（好適には、30分間乃至20時間）である。

【0104】

アミノ基の保護基が、低級脂肪族アシル類、芳香族アシル類、低級アルコキシカルボニル類又はシップ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合には、不活性溶媒及び水の

50

存在下に、酸又は塩基で加水分解することにより除去することができる。

【0105】

上記反応に使用される酸は、通常酸として使用されるもので反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、臭化水素酸、塩酸、硫酸、過塩素酸、リン酸、硝酸のような無機酸であり、好適には塩酸である。

【0106】

上記反応に使用される塩基は、化合物の他の部分に影響を与えないものであれば特に限定はないが、好適には、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシドのような金属アルコキシド類；又はアンモニア水、濃アンモニア-メタノールのようなアンモニア類であり、好適には、アルカリ金属水酸物である。

10

【0107】

上記反応に使用される溶媒は、通常の加水分解反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、メタノール、エタノール、*n*-ブロパノール、イソブロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソブロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；水；又は水と上記有機溶媒との混合溶媒であり、好適にはエーテル類（最も好適にはジオキサン）である。

20

【0108】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、溶媒及び使用される酸若しくは塩基等により異なり、特に限定はないが、副反応を抑制するために、通常、反応温度は、0℃乃至150℃であり、反応時間は、1時間乃至10時間である。

【0109】

アミノ基の保護基が低級アルケニルオキシカルボニル類である場合には、アミノの保護基が前記の脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシップ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合の除去反応における塩基処理と同様に行われる。

30

【0110】

尚、アリルオキシカルボニル基の場合は、特に、不活性溶媒中、パラジウム、及びトリフェニルホスフィン若しくはニッケルテトラカルボニルを使用して、保護基を除去する方法が簡便で、副反応が少なく実施することができる。

【0111】

使用される不活性溶媒は、反応を阻害せず、原料化合物をある程度溶解するものであれば、特に限定はないが、好適には、メタノール、エタノール、イソブロパノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソブロピルエーテル、*t*-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；又は酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類であり、さらに好適には、エーテル類（特に好適には、テトラヒドロフラン）又はニトリル類（特に好適には、アセトニトリル）である。

40

【0112】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、反応温度は、0℃乃至150℃（好適には0℃乃至100℃）であり、反応時間は、5分間乃至48時間（好適には30分間乃至24時間）である。

【0113】

ヒドロキシ基の保護基が、シリル類である場合には、前記アミノの保護基がシリル類である場合と同様に処理して除去される。

【0114】

50

ヒドロキシ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合には、前記アミノ基の保護基がアラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合と同様に処理して除去される。

## 【0115】

ヒドロキシ基の保護基が、低級アルコキシメチル類、テトラヒドロピラニル又はテトラヒドロチオピラニル類、テトラヒドロフラニル又はテトラヒドロチオフラニル類、又は置換されたエチル類である場合には、通常、不活性溶媒中、酸で処理することにより除去される。

## 【0116】

使用される酸としては、通常、ブレンステッド酸又はルイス酸として使用されるものであれば特に限定ではなく、好適には、塩化水素；塩酸、硫酸、硝酸のような無機酸；酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のような有機酸；又は三弗化ホウ素のようなルイス酸であり、好適には、塩酸又は酢酸であり、また、ダウエックス50Wのような強酸性の陽イオン交換樹脂も使用することができる。10

## 【0117】

上記反応に使用される溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；蟻酸エチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロヘキサンのようなケトン類；水；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、エーテル類（最も好適には、テトラヒドロフラン）又はアルコール類（最も好適には、メタノール）である。20

## 【0118】

反応温度及び反応時間は、原料化合物、使用される酸、溶媒等により異なるが、反応温度は、-10℃乃至200℃（好適には、0℃乃至150℃）であり、反応時間は、5分間乃至48時間（好適には、30分間乃至10時間）である。30

## 【0119】

ヒドロキシ基の保護基が、低級脂肪族アシル類、芳香族アシル類、低級アルコキシカルボニル基類又は低級アルケニルオキシカルボニル類である場合には、前記アミノの保護基が脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシップ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合の除去反応における塩基処理と同様に行われる。

## 【0120】

尚、ヒドロキシ基の保護基が、アリルオキシカルボニル基の場合は、特にパラジウム、及びトリフェニルホスфин、又はビス（メチルジフェニルホスфин）（1,5-シクロオクタジエン）イリジウム（I）・ヘキサフルオロホスフェートを使用して除去する方法が簡便で、副反応が少なく実施することができ、前記アミノ基の保護基がアリルオキシカルボニル基である場合と同様に処理して除去される。40

## 【0121】

カルボキシル基の保護基が、低級アルキル基又はアラルキル基である場合は、ヒドロキシ基の保護基が前記の脂肪族アシル類、芳香族アシル類又はアルコキシカルボニル類である場合の除去反応の条件と同様にして、塩基と処理することにより達成される。

## 【0122】

カルボキシル基の保護基が、アラルキル基である場合には、前記アミノの保護基がアラル50

キル類又はアラルキルオキシカルボニル基である場合と同様に、接触還元により除去することもできる。

【0123】

リン酸基の保護基が、シアノ基、置換されてもよいシリル基、アリール基、ヘテロシリクリル基、アリールチオ基、スルホニル基又はハロゲン原子により置換されても良い低級アルキル基である場合には、不活性溶媒中、水の存在下、酸で加水分解するか、あるいは、不活性溶媒中、ハロゲン化トリメチルシリル（例えば、プロモトリメチルシリル又はヨードトリメチルシリル）と反応させることにより該保護基が除去される。

【0124】

上記加水分解に使用される不活性溶媒は、例えば、メタノール、エタノールのようなアルコール類；又はジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類であり、好適にはエーテル類であり、最も好適にはジオキサンである。

【0125】

上記反応で使用される酸は、例えば、塩酸、硫酸、リン酸、硝酸のような無機酸であり、好適には塩酸である。

【0126】

反応温度は、0℃乃至150℃（好適には20℃乃至100℃）であり、反応温度は、1時間乃至60時間（好適には1時間乃至48時間）である。

【0127】

上記のハロゲン化トリメチルシリルとの反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノールのようなアルコール類；或いは上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類又はニトリル類（より好適には、クロロホルム、ジクロロメタン又はアセトニトリル）である。

【0128】

反応温度は、原料化合物、使用される溶媒の種類等によって異なるが、通常、-78℃乃至100℃（好適には0℃乃至80℃）である。

【0129】

反応時間は、原料化合物、使用される溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分乃至24時間（好適に1時間乃至6時間）である。

【0130】

リン酸基の保護基が低級アルケニル基である場合には、不活性溶媒中、アミン、蟻酸、蟻酸塩類、トリアルキルスズ化合物又は活性メチレン化合物の存在下、パラジウム化合物と反応させることにより、該保護基を除去することができる。

【0131】

上記反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタンのようなハロゲン化炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノールのようなアルコール類；酢酸のような有機酸類；水；又は上記溶媒と水との混合溶媒であり、好適には、ニトリル類又はエーテル類（特に好適には、アセトニトリル又はテトラヒドロフラン）である。

【0132】

上記反応で使用されるアミンは、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]

10

20

30

40

50

オクタン (DABCO) のような第三級アミン類；ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピロリジンのような第二級アミン類；又はエチルアミン、プロピルアミン、ブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジエチルアニリンのような第一級アミン類であり、好適には、ピロリジンである。

## 【0133】

上記反応で使用される蟻酸塩類は、好適には、蟻酸アンモニウム、蟻酸トリエチルアミン塩又は蟻酸n-ブチルアミン塩である。

## 【0134】

上記反応に使用されるトリアルキルスズ化合物は、好適には、トリメチルスズ、トリエチルスズ又はトリブチルスズであり、特に好適には、トリブチルスズである。 10

## 【0135】

上記反応で使用される活性メチレン化合物は、例えば、マロン酸メチル、マロン酸エチルのようなマロン酸エステル類；シアノ酢酸メチルのようなシアノ酢酸エステル類；アセト酢酸メチル、アセト酢酸エチル、ベンゾイル酢酸エチルのようなβ-ケト酢酸エステル類；アセチルアセトン、ベンゾイルアセトン、ジベンゾイルメタン、1, 3-シクロペニタジオン、1, 3-シクロヘキサジオン、ジメドンのような1, 3-ジケトン類；又は上記活性メチレン化合物のアルカリ金属塩であり、好適には、1, 3-ジケトン類（特に、ジメドン）又はマロン酸エステル類のナトリウム塩（特に、ジエチルマロン酸ナトリウム塩）である。

## 【0136】

20

上記反応で使用されるパラジウム化合物は、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、ジクロロジ（トリフェニルホスフィン）パラジウムのようなPd<sup>0</sup>化合物；又はジアセトキシパラジウム、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウムのようなPd<sup>1</sup>化合物であり、好適には、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムである。

## 【0137】

反応温度は、原料化合物、使用される溶媒の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には20℃乃至80℃）である。

## 【0138】

反応時間は、原料化合物、使用される溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分乃至48時間（好適に30分乃至24時間）である。 30

## 【0139】

リン酸基の保護基が、アリールメチル基である場合は、前記アミノの保護基がアラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル基である場合と同様に処理して除去される。

## 【0140】

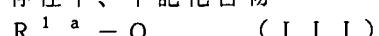
リン酸基の保護基が、アリール基である場合は、前記アミノ基の保護基が、低級脂肪族アシル類、芳香族アシル類、低級アルコキシカルボニル類又はシップ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合と同様に処理して除去される。

## 【0141】

リン酸基の保護基が、アミド類である場合、前記アミノの保護基が脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシップ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合の除去反応における酸処理と同様に行われる。 40

## 【0142】

アミノ基をアシル化する方法は、化合物（10）を、不活性溶媒中、塩基の存在下又は非存在下、下記化合物



[式中、R<sup>1a</sup>は、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基を示し、Qはハロゲン原子（好適には、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子）を示す。]と反応させることにより行なわれる。

## 【0143】

50

使用される不活性溶媒は、好適には、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類；アセトン、2-ブタノンのようなアルキルケトン類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；又は上記溶媒と水との混合溶媒であり、好適には、上記溶媒と水との混合溶媒（特に好適には、酢酸エチルと水との混合溶媒）である。

## 【0144】

10

使用される塩基は、例えば、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；水酸化マグネシウム、水酸化カルシウムのようなアルカリ土類金属水酸化物；又はトリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソブロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、ピロリジンのような有機アミン類であり、好適には、アルカリ金属炭酸水素塩類（特に好適には、炭酸水素カリウム）である。

## 【0145】

反応温度は、原料化合物、使用される塩基、使用される溶媒の種類等によって異なるが、0℃乃至50℃（好適には室温付近）である。

20

## 【0146】

反応時間は、原料化合物、使用される塩基、使用される溶媒、反応温度等により異なるが、30分間乃至10時間（好適には1時間乃至5時間）である。

## 【0147】

反応終了後、各反応の目的化合物（I-1）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、酸化剤が存在する場合は、適宜、還元剤で分解し、又は、不溶物が存在する場合には、適宜濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、分離、精製することができる。

30

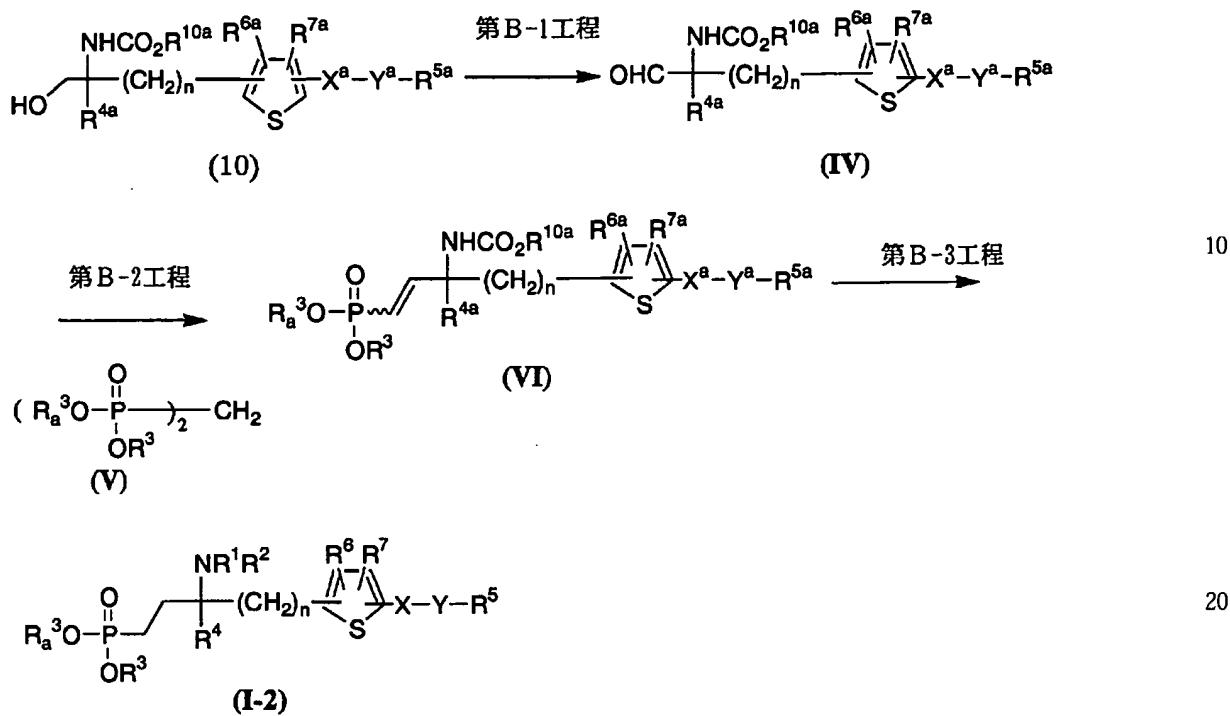
## 【0148】

B法は、化合物（I）において、Zがメチレンである化合物（I-2）を製造する方法である。

## 【0149】

## 【化10】

## B法



## 【0150】

上記式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>a</sup><sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>10a</sup>、X、X<sup>a</sup>、Y、Y<sup>a</sup>及びnは、前述したものと同意義を示す。

## 【0151】

第B-1工程は、一般式(10)を有する化合物を酸化して、一般式(I-2)を有するアルデヒド体を製造する工程である。

## 【0152】

酸化反応は、一級アルコールからアルデヒドを生成する酸化反応であれば、特に限定はないが、例えば、塩化メチレン中、ピリジン及びクロム酸を用いて行われるCollins酸化；塩化メチレン中、塩化クロム酸ピリジニウム(PCC)を用いて行われるPCC酸化；塩化メチレン中、ニクロム酸ピリジニウム(PDC)を用いて行われるPDC酸化；塩化メチレン中、親電子剤(例えば無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、塩化チオニル、塩化スルフリル、塩化オキザリル、ジシクロヘキシカルボジイミド、ジフェニルケテン-p-トリルイミン、N,N-ジエチルアミノアセチレン、三酸化硫黄・ピリジン錯体など)及びジメチルスルホキシド(DMSO)を用いて行われる、Swern酸化のような、DMSO酸化；塩化メチレン若しくはベンゼン中、二酸化マンガンを用いて行われる二酸化マンガン酸化；又は塩化メチレン中、Dess-Martinペルヨージナンを用いて行われるDess-Martin酸化であり、好適には、塩化メチレン中で行われる、Dess-Martin酸化、PDC酸化又はSwern酸化である。

## 【0153】

反応温度は、原料化合物、溶剤、酸化剤の種類等によって異なるが、通常、-78°C乃至100°Cであり、好適には、-78°C乃至30°Cである。

## 【0154】

反応時間は、原料化合物、溶媒、酸化剤の種類、反応温度等によって異なるが、通常10分間乃至2日間であり、好適には、30分間乃至24時間である。

## 【0155】

反応終了後、本反応の目的化合物であるアルデヒド体(I-2)は常法に従って、反応混合 50

物から採取される。例えば、酸化剤を亜硫酸水素ナトリウム水等で中和し、不溶物が存在する場合には濾過により除去後、そのまま濃縮すること或いは水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することによって得られる。

## 【0156】

得られたアルデヒド体（IV）は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を利用して分離、精製することができる。

## 【0157】

第B-2工程は、不活性溶媒中、塩基の存在下、アルデヒド体（IV）を一般式（V）を有する化合物と反応させ、 $\alpha$ 、 $\beta$ -不飽和リン酸エステル体（VI）に導く工程である。 10

## 【0158】

上記反応に使用される不活性溶媒は、出発物質をある程度溶解するものであれば、特に限定はないが、好適には、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、 $t$ -ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類；アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類；ホルムアミドのようなアミド類；又はジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類であり、さらに好適には、芳香族炭化水素類又はエーテル類（特に好適には、ベンゼン又はテトラヒドロフラン）である。

## 【0159】

使用される塩基は、化合物（V）と反応させて、相当するカルバニオンを生成させるものであれば、特に限定はないが、好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムメトキシド、カリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；N-メチルモルホリン、トリエチルアミンのような有機アミン類；又はブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機金属塩基類であり、さらに好適には、アルカリ金属アルコキシド類、アルカリ金属水素化物類及び有機金属塩基類であり、特に好適には、水素化ナトリウムである。 30

## 【0160】

反応温度は、原料化合物、溶剤、ホスホニウム塩の種類、塩基の種類等によって異なるが、通常、-80°C乃至100°Cであり、好適には、-20°C乃至50°Cである。

## 【0161】

反応時間は、原料化合物、溶剤、ホスホニウム塩の種類、塩基の種類等によって異なるが、通常10分間乃至2日間であり、好適には、10分間乃至12時間である。

## 【0162】

反応終了後、本反応の目的化合物である不飽和リン酸エステル化合物（VI）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応液を希塩酸等で中和し、不溶物が存在する場合には濾過により除去後、そのまま濃縮すること或いは水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することによって得られる。 40

## 【0163】

得られた不飽和リン酸エステル化合物（VI）は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を用いて、分離、精製することができる。

## 【0164】

第B-3工程は、一般式（I-2）を有する化合物を製造する工程であり、不飽和リン酸エステル化合物（VI）を不活性溶媒中、接触還元触媒の存在下、水素と反応させ、所望により、式  $\text{CO}_2 \text{R}^{10a}$  を有する基を含むアミノ基の保護基を除去し、ヒドロキシの保護基を除去し、カルボキシル基の保護基を除去し、リン酸基の保護基を除去し及び／又は 50

アミノ基をアシル化することにより行われる。

【0165】

不飽和リン酸エステル化合物(VI)を水素と反応させる反応で使用される不活性溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば、特に限定はないが、好適には、メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、*t*-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；又は酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類であり、さらに好適には、アルコール類（特に好適には、メタノール又はエタノール）である。

10

【0166】

使用される接触還元触媒は、好適には、パラジウム-炭素、水酸化パラジウム-炭素、パラジウム黒、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム(Wilkinson錯体)、パラジウム-硫酸バリウム、ラネーニッケルであり、さらに好適には、パラジウム-炭素又はトリフェニルホスフィン-塩化ロジウム(Wilkinson錯体)である。

【0167】

水素の圧力は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われる。

【0168】

反応温度は、原料化合物、溶剤、塩基の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には、室温乃至60℃）である。

20

【0169】

反応時間は、原料化合物、反応温度、溶剤、塩基の種類によって異なるが、通常、5分間乃至96時間（好適には、1時間乃至48時間）である。

【0170】

反応終了後、本反応の目的化合物(I-2)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィーを用いて、分離、精製することができる。

30

【0171】

所望により行われる、アミノ基の保護基を除去する反応、ヒドロキシの保護基を除去する反応、カルボキシル基の保護基を除去する反応、リン酸基の保護基を除去する反応及びアミノ基をアシル化する反応は、前述の第A-1工程と同様に行うことができる。

【0172】

原料化合物(10)は、公知化合物であるか又は公知方法に従って容易に製造される（例えば、WO02/06268号公報参照）。また、以下の方法によっても製造することができる。

40

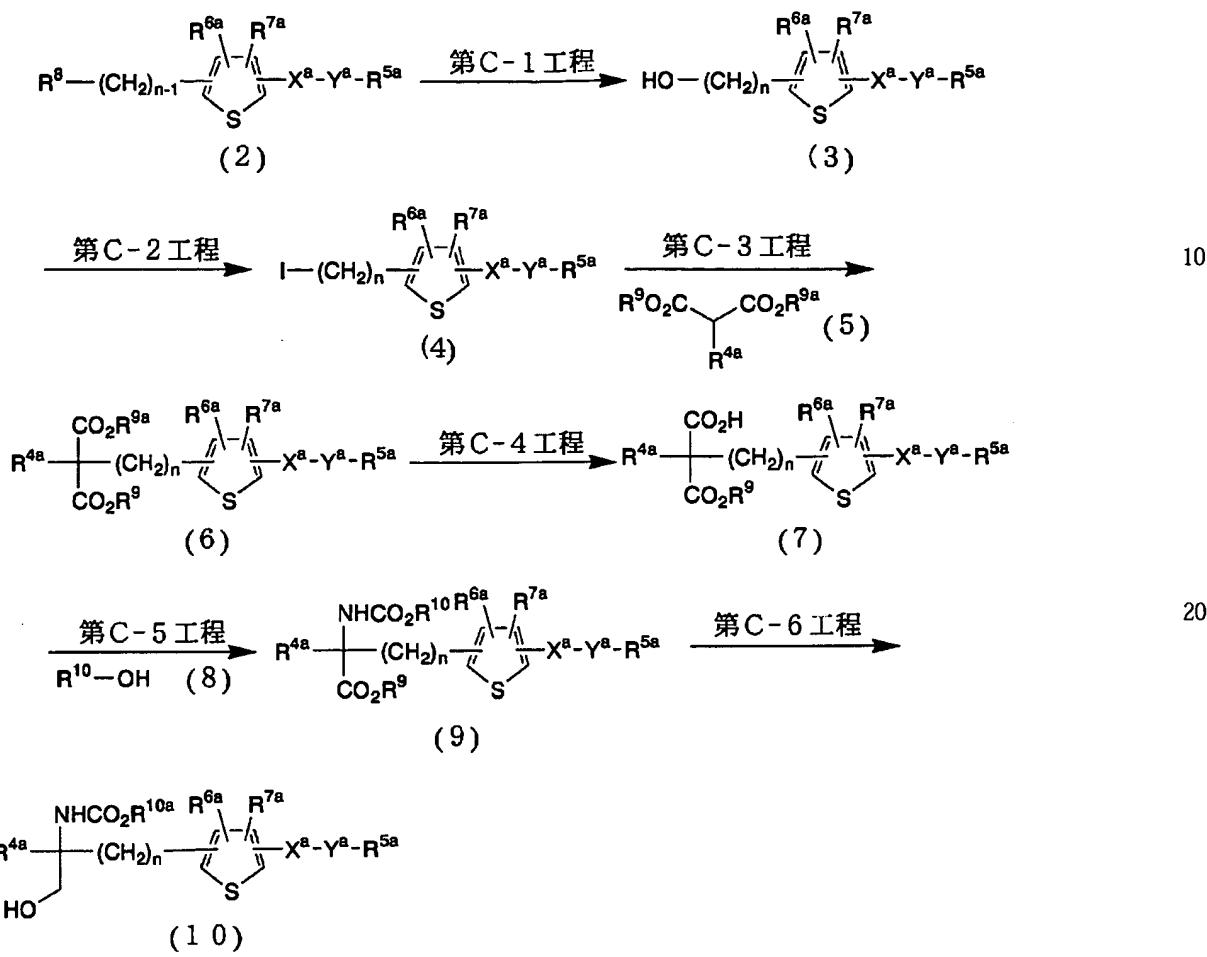
【0173】

C法は、化合物(10)を製造する方法である。

【0174】

【化11】

## C法



## 【0175】

上記式中、R<sup>4a</sup>、R<sup>5a</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>10a</sup>、X<sup>a</sup>、Y<sup>a</sup>及びnは、前述したものと同意義を示し、R<sup>8</sup>は、ホルミル基、カルボキシル基又は低級アルコキシカルボニル基を示し、R<sup>9</sup>及びR<sup>9a</sup>は、同一又は異なって、低級アルキル基を示し、R<sup>10</sup>は、低級脂肪族アシル基を示す。

## 【0176】

第C-1工程は、一般式(3)を有する化合物を製造する工程であり、一般式(2)を有する化合物を、不活性溶媒中、塩基の存在下又は非存在下(好適には存在下)、還元剤と反応させることにより行われる。尚、化合物(2)は、公知化合物であるか、又は公知方法に従って容易に製造される(例えば、WO 02/06268号公報参照)。

40

## 【0177】

上記反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；酢酸、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンオール、メチルセロソルブのようなア

50

ルコール類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、エーテル類（最も好適には、テトラヒドロフラン）である。

## 【0178】

上記反応に使用される塩基は、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、ピロリジンのような有機アミン類であり、好適には、トリエチルアミンである。

## 【0179】

上記反応に使用される還元剤は、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような水素化ホウ素アルカリ金属類；又は水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリエトキシアルミニウムリチウムのような水素化アルミニウム化合物であり、好適には、水素化ホウ素アルカリ金属類（最も好適には、水素化ホウ素ナトリウム）である。

10

## 【0180】

反応温度は、原料化合物、使用される還元剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、一50℃乃至100℃（好適には0℃乃至50℃）である。

## 【0181】

反応時間は、原料化合物、使用される還元剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至150時間（好適には、1時間乃至100時間）である。

## 【0182】

20

反応終了後、本反応の目的化合物（3）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を用いて、分離、精製することができる。

## 【0183】

第C-2工程は、一般式（4）を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物（3）のヒドロキシ基を脱離基に変換した後、沃素化剤と反応させることにより行われる。

30

## 【0184】

ヒドロキシ基を脱離基に変換する試薬は、例えば、メタンスルホニルクロリド、P-トルエンスルホニルクロリドのようなスルホニルハライド；チオニルクロリド、チオニルプロミド、チオニルアイオダイドのようなチオニルハライド類；スルフリルクロリド、スルフリルプロミド、スルフリルアイオダイドのようなスルフリルハライド類；三塩化燐、三臭化燐、三沃化燐のような三ハロゲン化燐類；五塩化燐、五臭化燐、五沃化燐のような五ハロゲン化燐類；オキシ塩化燐、オキシ臭化燐、オキシ沃化燐のようなオキシハロゲン化燐類；のようなハロゲン化剤；又はメチルトリオキソレニウム（VII）のようなレニウム試薬であり、好適には、スルホニルハライド（特にP-トルエンスルホニルクロリド）である。

40

## 【0185】

ヒドロキシ基を脱離基に変換させる際に使用される塩基は、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩類；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物類；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；又はトリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン

50

、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジエチルアニリン、1, 5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン、1, 4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABC<sub>O</sub>)、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)のような有機アミン類であり、好適には、有機アミン類(最も好適には、トリエチルアミン)である。

## 【0186】

ヒドロキシ基を脱離基に変換させる際に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘブタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトン、2-ブタノンのようなケトン類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；又はスルホランであり、好適には、ハロゲン化炭化水素類(最も好適には、ジクロロメタン)である。

10

## 【0187】

ヒドロキシ基を脱離基に変換させる際の反応温度は、原料化合物、使用される試薬、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-50℃乃至200℃(好適には、-10℃乃至150℃)である。

## 【0188】

ヒドロキシ基を脱離基に変換させる際の反応時間は、原料化合物、使用される試薬、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至12時間)である。

20

## 【0189】

上記反応に使用される沃素化剤は、例えば、五沃化燐、オキシ沃化燐、沃化ナトリウム、沃化カリウムであり、好適には、沃化ナトリウムである。

## 【0190】

脱離基を沃素化する際の反応温度は、原料化合物、使用される試薬、溶媒の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至200℃(好適には、10℃乃至150℃)である。

30

## 【0191】

脱離基を沃素化する際の反応時間は、原料化合物、使用される試薬、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至24時間(好適には30分間乃至12時間)である。

## 【0192】

反応終了後、本反応の目的化合物(4)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗净後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を用いて、分離、精製することができる。

40

## 【0193】

第C-3工程は、一般式(6)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物(4)を、塩基の存在下、一般式(5)を有する化合物と反応させることにより行われる。

## 【0194】

上記反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミ

50

ド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、アルコール類又はアミド類（最も好適には、ジメチルホルムアミド）である。

## 【0195】

上記反応に使用される塩基は、例えば、前記第C-2工程のヒドロキシ基を脱離基に変換させる際に使用されるものと同様なものであり、好適には、アルカリ金属水素化物類又はアルカリ金属アルコキシド類（最も好適には、水素化ナトリウム）である。

## 【0196】

反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-78°C乃至100°C（好適には、0°C乃至50°C）である。

10

## 【0197】

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至48時間（好適には、30分間乃至12時間）である。

## 【0198】

反応終了後、本反応の目的化合物（6）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を用いて、分離、精製することができる。

20

## 【0199】

第C-4工程は、一般式（7）を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、水の存在下、化合物（6）を塩基と反応させ、1個の低級アルコキカルボニル基を加水分解することにより行われる。

## 【0200】

上記反応に使用される不活性溶媒は、本反応に不活性なものであれば特に限定はされないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレンジリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレンジリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサンノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、アルコール類（最も好適には、エタノール）である。

30

## 【0201】

上記反応に使用される塩基は、例えば、前記C-2工程のヒドロキシ基を脱離基に変換させる際に使用されるものと同様なものであり、好適には、アルカリ金属水酸化物類（最も好適には、水酸化カリウム）である。

40

## 【0202】

反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-20°C乃至200°C（好適には、0°C乃至50°C）である。

## 【0203】

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、30分間乃至120時間（好適には、1時間乃至80時間）である。

## 【0204】

反応終了後、本反応の目的化合物（7）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等

50

で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィーを用いて、分離、精製することができる。

【0205】

第C-5工程は、一般式(9)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(7)のカルボキシル基をクルチウス転位反応に付し、カルバメートに変換する方法であり、化合物(7)を、不活性溶媒中、塩基の存在下、ジフェニルリン酸アジドのようなジアリールリン酸アジド誘導体と反応させた後、一般式(8)を有する化合物と反応させることにより行われる。

【0206】

上記反応に使用される不活性溶媒は、本反応に不活性なものであれば特に限定はされないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；又は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には芳香族炭化水素類（最も好適には、ベンゼン）である。

10

【0207】

上記反応に使用される塩基は、例えば、前記第C-2工程のヒドロキシ基を脱離基に変換させる際に使用されるものと同様なものであり、好適には、有機アミン類（最も好適には、トリエチルアミン）である。

20

【0208】

化合物(7)をジアリールリン酸アジド誘導体と反応させる際の反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至200℃（好適には、20℃乃至150℃）である。

【0209】

化合物(7)をジアリールリン酸アジド誘導体と反応させる際の反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至24時間（好適には30分間乃至12時間）である。

30

【0210】

化合物(7)をジアリールリン酸アジド誘導体と反応させた後、同一の反応溶液中で、化合物(8)を加えて反応させる。

【0211】

反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至200℃（好適には、20℃乃至150℃）である。

【0212】

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至24時間（好適には30分間乃至12時間）である。

40

【0213】

また、化合物(7)をジアリールリン酸アジド誘導体と反応させる際に、化合物(8)のうち、ジアリールリン酸アジド誘導体と直接反応しにくいものを一緒に反応させることにより、カルボキシル基を一気にカルバメートに変換することができる。

【0214】

反応終了後、本反応の目的化合物(9)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等を用いて、分離、精製することができる。

50

## 【0215】

第C-6工程は、一般式(10)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(9)のエステル部分を還元し、所望により、式 $\text{CO}_2\text{R}^{10}$ を有する基を除去し、低級脂肪族アシル化又は低級アルコキシカルボニル化(アシル化)することにより行なわれる。

## 【0216】

化合物(9)のエステル部分を還元する反応は、前記C-1工程と同様に行われる。

## 【0217】

式 $\text{CO}_2\text{R}^{10}$ を有する基を除去する反応及びアシル化は、前記A-1工程と同様に行われる。

## 【0218】

本発明の一般式(I)を有するリン酸又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有し、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chronic病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、尋常、Sydenham舞蹈病、全身性硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、真菌、マイコプラズマ、ウイルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞蹈病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患(特に好適には、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患)の、温血動物用(特に、ヒト用)の予防剤若しくは治療剤(特に、治療薬)として有用である。

## 【0219】

本発明の一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを、上記疾患の治療剤又は予防剤として使用する場合には、それ自体或は適宜の薬理学的に許容される、賦形剤、希釈剤等と混合し、例えば、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくはシロップ剤等による経口的又は注射剤若しくは坐剤等による非経口的に投与することができる。

## 【0220】

これらの製剤は、賦形剤(例えば、乳糖、白糖、葡萄糖、マンニトール、ソルビトールのような糖誘導体；トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、 $\alpha$ 澱粉、デキストリンのような澱粉誘導体；結晶セルロースのようなセルロース誘導体；アラビアゴム；デキストラン；プルランのような有機系賦形剤；及び、軽質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、珪酸カルシウム、メタ珪酸アルミニン酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体；リン酸水素カルシウムのようなリン酸塩；炭酸カルシウムのような炭酸塩；又は硫酸カルシウムのような硫酸塩等の無機系賦形剤である。)、滑沢剤(例えば、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩；タルク；コロイドシリカ；ビーガム、ゲイ蝶のようなワックス類；硼酸；アジピン酸；硫酸ナトリウムのような硫酸塩；グリコール；フマル酸；安息香酸ナトリウム；DLロイシン；脂肪酸ナトリウム

10

20

30

40

50

塩；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩；無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類；又は上記澱粉誘導体である。）、結合剤（例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、マクロゴール、又は、前記賦形剤と同様の化合物である。）、崩壊剤（例えば、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシルメチルセルロース、カルボキシルメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシルメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体；カルボキシルメチルスターチ、カルボキシルメチルスターチナトリウム又は架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾されたデンプン・セルロース類である。）、安定剤（例えば、メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類；クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類；塩化ベンザルコニウム；フェノール、クレゾールのようなフェノール類；チメロサール；デヒドロ酢酸；又はソルビン酸である。）、嬌味嬌臭剤（例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、香料等である。）、希釈剤等の添加剤を用いて周知の方法で製造される。

10

## 【0221】

その使用量は症状、年齢等により異なるが、経口投与の場合には、1回当たり1日下限0.05mg（好適には、5mg）、上限200mg（好適には、40mg）を、静脈内投与の場合には、1回当たり1日下限0.01mg（好適には、1mg）、上限100mg（好適には、10mg）を成人に対して、1日当たり1乃至6回症状に応じて投与することが望ましい。

20

## 【0222】

## 【実施例】

以下に、実施例および試験例を示し、本発明を更に詳細に説明するが、本発明の範囲はこれらに限定されるものではない。

## 【0223】

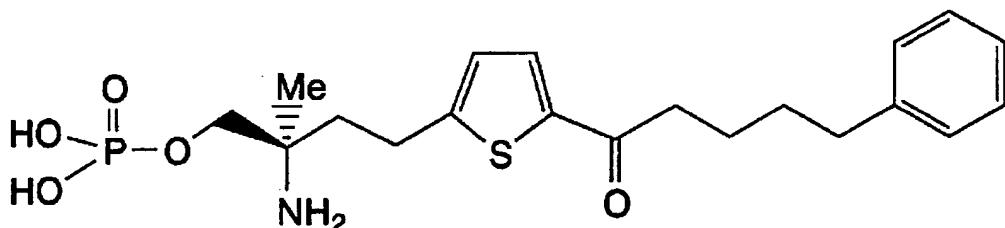
## （実施例1）

リン酸モノ-(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペントノイル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル

## 【0224】

## 【化12】

30



## 【0225】

## (a)

40

酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル

参考例2で合成した酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-ブロモチオフェン-2-イル)ブチルエステル4.00g(11.5mmol)をジメチルホルムアミド40mLに溶解させ、参考例4で合成した5-フェニルペント-1-イニン4.97g(34.5mmol)、トリエチルアミン16.0mL(115mmol)、ヨウ化銅(I)437mg(2.30mmol)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム806mg(1.15mmol)を加え、窒素雰囲気下80℃で2時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液と混合し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水及び

50

飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル=1/1～1/2）で精製し、さらに分取HPLC（カラム：T S K g e 1 O D S - 8 0 T s 5 5 × 3 0 0 m m、溶出溶媒：アセトニトリル／水=1/1、流速5 0 m L / m i n）で精製して、標記化合物を無色油状態物として、3. 2 7 g（収率6 9 %）得た。

核磁気共鳴スペクトル（4 0 0 M H z, C D C l<sub>3</sub>），δ：1. 3 6 (3 H, s), 1. 8 5 - 2. 0 5 (3 H, m), 1. 9 4 (3 H, s), 2. 1 0 (3 H, s), 2. 2 5 - 2. 3 5 (1 H, m), 2. 4 3 (2 H, t, J = 7. 0 H z), 3. 7 0 - 3. 8 0 (4 H, m), 4. 1 7 (1 H, d, J = 1 1. 2 H z), 5. 3 8 (1 H, 1. 2 H z), 4. 3 1 (1 H, d, J = 1 1. 2 H z), 6. 6 4 (1 H, d, J = 3. 6 H z), 6. 9 4 (1 H, d, J = 3. 6 H z), 7. 1 5 - 7. 4 2 (5 H, m)。

マススペクトル（F A B），m/z：4 1 2 ((M + H)<sup>+</sup>)。

### 【0 2 2 6】

(b)

(2 R) - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール

実施例1 (a) で得られた酢酸（2 R）-アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) チオフェン - 2 - イル] ブチル エステル3. 2 7 g (7. 9 5 m m o 1) をテトラヒドロフラン2 0 m L、メタノール2 0 m L及び水2 0 m Lに溶解させ、水酸化リチウム - 水和物3. 3 3 g (7 9. 5 m m o 1) を加え、5 0 ℃で6 時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をメタノール2 5 m Lに溶解させ、6 規定硫酸2 5 m Lを加え1 0 0 ℃で2 時間攪拌した。反応液に氷冷下2 0 %水酸化ナトリウム水溶液を加えアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（シリカゲル：C h r o m a t o r e x N H、1 0 0 - 2 0 0 m e s h、溶出溶媒：塩化メチレン／メタノール=1/0～5 0 / 1）により精製して標記化合物を淡黄色固体として2. 1 3 g（収率7 6 %）得た。

核磁気共鳴スペクトル（4 0 0 M H z, C D<sub>3</sub> O D），δ：1. 0 9 (3 H, s), 1. 6 2 - 1. 8 6 (6 H, m), 2. 6 4 (2 H, t, J = 7. 1 H z), 2. 8 4 - 2. 9 8 (4 H, m), 3. 3 4 (1 H, d, J = 1 0. 8 H z), 3. 3 8 (1 H, d, J = 1 0. 8 H z), 6. 9 3 (1 H, d, J = 3. 7 H z), 7. 1 0 - 7. 2 8 (5 H, m), 7. 6 8 (1 H, d, J = 3. 7 H z)。

マススペクトル（F A B），m/z：3 4 6 ((M + H)<sup>+</sup>)。

### 【0 2 2 7】

(c)

(2 R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール

40

実施例1 (b) で得られた（2 R）-アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペントノイル) チオフェン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール7 2 4 m g (2. 0 9 m m o 1) を塩化メチレン8 m Lに溶解し、1 規定水酸化ナトリウム水溶液8 m L及びジ - t - プチルジカルボネート6 8 4 m g (3. 1 3 m m o 1) を加え、室温で2 時間攪拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、水を加えて分液した。塩化メチレン層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル=3/2）により精製して標記化合物を白色固体として8 9 0 m g（収率9 5 %）得た。

核磁気共鳴スペクトル（4 0 0 M H z, C D C l<sub>3</sub>），δ：1. 2 1 (3 H, s), 1. 4 3 (9 H, s), 1. 6 6 - 1. 8 3 (4 H, m), 1. 9 7 - 2 5 0

. 0 6 ( 1 H, m ), 2. 1 3 - 2. 2 1 ( 1 H, m ), 2. 6 1 - 2. 6 8 ( 2 H, m ), 2. 7 8 - 2. 9 8 ( 4 H, m ), 3. 6 4 - 3. 7 2 ( 2 H, m ), 3. 9 6 ( 1 H, b r s ), 4. 6 3 ( 1 H, b r s ), 6. 8 4 ( 1 H, d, J = 3. 9 H z ), 7. 1 3 - 7. 3 0 ( 5 H, m ), 7. 5 1 ( 1 H, d, J = 3. 9 H z )。

マススペクトル ( F A B ), m/z : 4 4 6 ((M + H)<sup>+</sup>)。

【 0 2 2 8 】

( d )

リン酸 ビスーアリルーモノー ( 2 R ) - t - プトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンタノイル ) チオフェン - 2 - イル ] プチル エステル  
実施例 1 ( c ) で得られた ( 2 R ) - t - プトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンタノイル ) チオフェン - 2 - イル ] プタン - 1 - オール 7 7 7  
m g ( 1. 7 4 m m o l ) を塩化メチレン 8 m L に溶解し、テトラゾール 8 2 0 m g ( 1  
1. 7 m m o l ) を加えた。氷冷下、ジアリルジイソプロピルホスホロアミダイト 9 2 2  
μ L ( 3. 4 9 m m o l ) を加えた。氷冷下 5 分攪拌後室温に戻し 2 時間攪拌した。氷冷  
下メタノール 1 m L を加え、5 - 6 M t - プチルハイドロパーオキサイド - デカン溶液  
1. 0 5 m L ( 5. 2 2 m m o l ) をゆっくり加えた。氷冷下 1 0 分攪拌後、飽和亜硫酸  
ナトリウム水溶液 1 0 m L を加え、塩化メチレンで希釈し分液した。塩化メチレン層を水  
、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー ( 展開溶媒 : ヘキサン / 酢酸エチル = 3 / 2 ) により精製し  
て標記化合物を無色油状物として 4 2 0 m g ( 収率 4 6 % ) 得た。

10

20

30

【 0 2 2 9 】

核磁気共鳴スペクトル ( 4 0 0 M H z , C D C l<sub>3</sub> ), δ : 1. 3 2 ( 3 H, s ), 1. 4 4 ( 9 H, s ), 1. 6 6 - 1. 8 2 ( 4 H, m ), 1. 8 8 - 1  
2. 9 8 ( 1 H, m ), 2. 2 1 - 2. 3 3 ( 1 H, m ), 2. 6 3 - 2. 6 8 ( 2 H, m ), 2. 8 2 - 2. 8 7 ( 4 H, m ), 3. 9 8 - 4. 0 4 ( 1 H, m ), 4. 1 5 - 4. 2 1 ( 1 H, m ), 4. 5 3 - 4. 5 9 ( 4 H, m ), 4. 6 4 ( 1 H, b R r s ), 5. 2 4 - 5. 4 1 ( 4 H, m ), 5. 5 9 - 6  
0. 0 0 ( 2 H, m ), 6. 8 3 ( 1 H, d, J = 3. 7 H z ), 7. 1 4 - 7  
2. 3 0 ( 5 H, m ), 7. 5 1 ( 1 H, d, J = 3. 7 H z )。

マススペクトル ( F A B ), m/z : 6 0 6 ((M + H)<sup>+</sup>)。

30

【 0 2 3 0 】

( e )

リン酸 モノー ( 2 R ) - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンタノイル ) チオフェン - 2 - イル ] プチル エステル  
実施例 1 ( d ) で得られたリン酸 ビスーアリルーモノー ( 2 R ) - t - プトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンタノイル ) チオフェン - 2 - イル ] プチル エステル 4 0 0 m g ( 0. 6 6 m m o l ) をアセトニトリル 5 m L に溶解し  
、テトラキス ( トリフェニルホスフィン ) パラジウム 3 7 m g ( 0. 0 3 m m o l ) を加えた。氷冷下ピロリジン 1 3 5 μ L ( 1. 6 2 m m o l ) を加えた。氷冷下 3 0 分攪拌後  
、室温に戻し、1 時間 3 0 分攪拌した。溶媒を減圧下留去し、分取 H P L C ( カラム : I  
n e r t s i l I O D S - 3 2 0 × 2 5 0 m m 、溶出溶媒 : アセトニトリル / 0. 1  
% 酢酸アンモニウム水溶液 = 1 / 1 、流速 : 1 0 m L / 分 ) にて精製した。精製物をエタノール 2 m L に溶解し、氷冷下 4 規定塩酸ジオキサン溶液を 2 m L 加えた。氷冷下 3 0 分攪拌後、室温に戻し、4 時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、メタノール - 水より再結晶し、標記化合物を淡黄色結晶として 1 1 5 m g ( 収率 5 1 % ) 得た。

40

核磁気共鳴スペクトル ( 4 0 0 M H z , D M S O - d<sub>6</sub> ), δ : 1. 2 2 ( 3 H, s ), 1. 5 2 - 1. 6 5 ( 4 H, m ), 1. 8 3 - 2. 0 5 ( 2 H, m ), 2. 5 2 - 2. 6 3 ( 2 H, m ), 2. 8 1 - 2. 9 7 ( 4 H, m ), 3. 7  
1 - 3. 8 8 ( 2 H, m ), 6. 9 8 ( 1 H, d, J = 3. 7 H z ), 7. 1 5 0

4-7.28 (5 H, m), 7.74 (1 H, d,  $J = 3.7$  Hz)。  
マススペクトル (FAB),  $m/z$ : 426 ((M + H)<sup>+</sup>)。

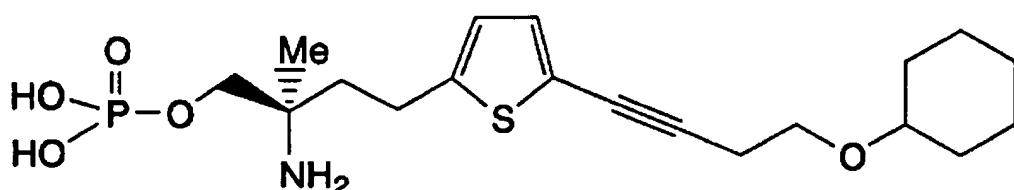
【0231】

(実施例2)

リン酸モノ-(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル

【0232】

【化13】



10

【0233】

(a)

(2R)-アリルオキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール

20

参考例6で合成した(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール マレイイン酸塩50.0mg (1.11mmol)に1規定水酸化ナトリウム水溶液10mLを加え、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を酢酸エチル8mL及び水8mLに溶解し、炭酸水素カリウム141mg (1.33mmol)及びクロロギ酸アリル133μL (1.33mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液を水にあけ、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=2/1~3/2)により精製して標記化合物を無色油状物として465mg (100%) 得た。

30

【0234】

核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ : 1.15-1.35 (8H, m), 1.50-1.60 (1H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 1.88-2.03 (3H, m), 2.08-2.18 (1H, m), 2.67 (2H, t,  $J = 7.2$  Hz), 2.72-2.90 (2H, m), 3.27-3.34 (1H, m), 3.47 (1H, brs), 3.62-3.75 (4H, m), 4.53 (2H, d,  $J = 5.7$  Hz), 4.82 (1H, brs), 5.22-5.35 (2H, m), 5.86-5.97 (1H, m), 6.63 (1H, d,  $J = 3.6$  Hz), 6.93 (1H, d,  $J = 3.6$  Hz)。

40

マススペクトル (FAB),  $m/z$ : 420 ((M + H)<sup>+</sup>)。

【0235】

(b)

リン酸モノ-(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル

実施例2(a)で得られた(2R)-アリルオキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール465mg (1.11mmol)を塩化メチレン10mLに溶解し、テトラゾール465mg (6.64mmol)を加え、氷冷下、ジアリルジイソプロピルホスホロアミダイト1.17mL (4.43mmol)を加えた。室温で1時間攪拌後、氷冷下5

50

— 6 M t-ブチルハイドロパーオキサイド-デカン溶液 0. 66 mL (3. 32 mmol) をゆっくり加えた。氷冷下 5 分攪拌後、10% チオ硫酸ナトリウム水溶液 10 mL を加え、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 3/1 ~ 3/2) により精製した。得られた精製物 24.8 mg (0.43 mmol) をアセトニトリル 5 mL に溶解し、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム 25 mg (0.02 mmol) を加え、さらに氷冷下ピロリジン 179  $\mu$ L (2.14 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。析出した沈殿をろ取り、アセトニトリル及び 0.1% 酢酸アンモニウム水溶液の混合物 (1:1) 10 mL を加えて加熱し、放置した。得られた沈殿をろ取り、乾燥し、標記化合物を白色結晶として 3.5 mg (8%) 得た。 10

## 【0236】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>COOD),  $\delta$ : 1.15 - 1.40 (5H, m), 1.43 (3H, s), 1.49 - 1.57 (1H, m), 1.70 - 1.80 (2H, m), 1.90 - 1.98 (2H, m), 2.01 - 2.22 (2H, m), 2.68 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 2.84 - 3.00 (2H, m), 3.37 - 3.46 (1H, m), 3.71 (2H, t,  $J$  = 6.6 Hz), 4.08 - 4.16 (2H, m), 6.73 (1H, d,  $J$  = 3.7 Hz), 6.96 (1H, d,  $J$  = 3.7 Hz)。

マススペクトル (FAB), m/z: 414 ((M + H)<sup>+</sup>)。 20

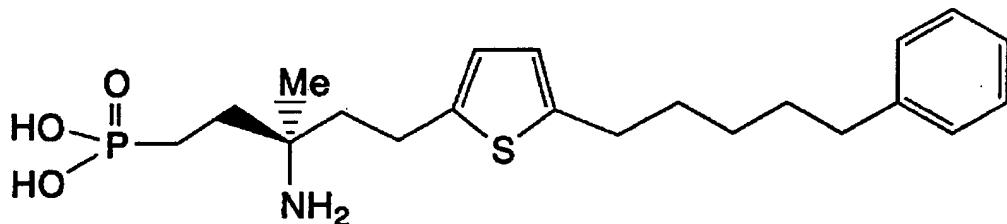
## 【0237】

## (実施例 3)

(3R)-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

## 【0238】

## 【化14】



30

## 【0239】

## (a)

(2R)-t-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブタナール

参考例 8 で得られた (2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール 1.26 g (3.97 mmol) を塩化メチレン 25 mL に溶解させ、氷冷攪拌下、ジ-t-ブチルジカーボネート 1.04 g (4.76 mmol) 及びトリエチルアミン 0.55 mL (3.97 mmol) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) により精製して、N-t-ブトキシカルボニル体 (N-Boc 体) を 1.12 g (収率 70%) 得た。N-Boc 体 150 mg (0.35 mmol) を塩化メチレン 7.5 mL に溶解させ、氷冷攪拌下、1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンズイオドキソール-3 (1H)-オン (Dess-Martin 試薬) 222 mg (0.52 mmol) を加え、室温にて 1.5 時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶 50

液を加え、室温にて30分攪拌し、水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）により精製して標記化合物を無色シロップとして150mg（収率100%）得た。

## 【0240】

核磁気共鳴スペクトル（400MHz, CDCl<sub>3</sub>），δ：9.33（s, 1H），7.42-7.23（m, 2H），7.22-7.17（m, 3H），6.54（d, 1H, J=3.66Hz），6.53（d, 1H, J=3.66Hz），5.25-5.11（brs, 1H），2.73（t, 2H, J=7.70Hz），2.41-2.26（m, 1H），2.12-2.00（m, 1H），2.71-1.58（m, 4H），1.45（s, 9H），1.51-1.32（m, 2H），1.38（s, 3H）。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 3443, 3413, 2981, 2934, 2858, 1708, 1495, 1453, 1369, 1253, 1164, 1074。

マススペクトル (FAB), m/z : 430 ((M + H)<sup>+</sup>)。

## 【0241】

(b)

(3R)-t-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ペンテニルホスホン酸 ジエチルエステルテトラエチル メチレンジホスホネット0.56mL (2.26mmol) をベンゼン1.5mLに溶解させ、冰冷攪拌下、60%水素化ナトリウム90mg (2.17mmol) を加えた。その後、室温にて30分攪拌した後、実施例3(a)で得られた(2R)-t-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブタナール194mg (0.45mmol) を加え、室温にて2時間攪拌した。反応終了後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、有機層を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1/1）により精製して標記化合物を無色シロップとして227mg（収率89%）得た 30。

## 【0242】

核磁気共鳴スペクトル（400MHz, CDCl<sub>3</sub>），δ：7.29-7.26（m, 2H），7.19-7.16（m, 3H），6.76（dd, 1H, J=17.6, 22.7Hz），6.56-6.53（m, 2H, ），5.70（dd, 2H, J=17.6, 17.8Hz）4.65-4.55（brs, 1H），4.18-4.02（m, 4H），2.80-2.67（m, 4H），2.61（t, 2H, J=7.69Hz），2.23-2.21（m, 1H），2.08-1.90（m, 1H），1.73-1.55（m, 4H），1.43（s, 9H），1.34（t, 6H, 40J=6.97Hz）。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CDCl<sub>3</sub>) : 3443, 2982, 2933, 2858, 2244, 1718, 1495, 1454, 1368, 1245, 1166, 1057, 1029。

マススペクトル (FAB), m/z : 564 ((M + H)<sup>+</sup>)。

## 【0243】

(c)

(3R)-t-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸 ジエチルエステル

実施例 3 (b) で得られた (3R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンチル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ペンテニルホスホン酸ジエチルエステル 100 mg (0.18 mmol) をエタノール 4 mL に溶解させ、室温攪拌下、クロロトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム 82 mg を加え、水素雰囲気下、70 °C にて 5 時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン / �酢酸エチル = 1 / 3) により精製して、標記化合物を無色シロップとして 62 mg (収率 62 %) 得た。

## 【0244】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ: 7.31 - 7.23 (m, 2 H), 7.22 - 7.13 (m, 3 H), 6.56 (d, 1 H, J = 2.93 Hz), 6.53 (d, 1 H, J = 2.93 Hz), 4.42 - 4.23 (brs, 1 H), 4.18 - 4.01 (m, 4 H), 2.80 - 2.65 (m, 4 H), 2.61 (t, 2 H, J = 7.70 Hz), 2.22 - 2.08 (m, 2 H), 1.91 - 1.53 (m, 10 H), 1.43 (s, 9 H), 1.33 (t, 6 H, J = 7.33 Hz), 1.21 (s, 3 H)。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>): 3443, 2984, 2935, 1714, 1498, 1454, 1392, 1368, 1165, 1063, 1031, 967。

マススペクトル (FAB), m/z: 566 ((M + H)<sup>+</sup>)。

20

## 【0245】

(d)

(3R) - アミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

実施例 3 (c) で得られた (3R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンチル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸ジエチルエステル 63 mg (0.11 mmol) に 4 規定塩酸ジオキサン溶液 3 mL と水 1 mL を加え、80 °C にて 8 時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去した。残渣をメタノール 0.5 mL に溶解し、水 5 mL 加え、再結晶を行い、表記化合物 28 mg (収率 62 %) 得た。

30

## 【0246】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD), δ: 7.25 - 7.18 (m, 2 H), 7.18 - 7.19 (m, 3 H), 6.64 (d, 1 H, J = 3.30 Hz), 6.56 (d, 1 H, J = 3.30 Hz), 2.83 (t, 2 H, J = 8.79 Hz), 2.74 (t, 2 H, J = 7.33 Hz), 2.05 - 1.85 (m, 4 H), 1.72 - 1.56 (m, 6 H), 1.44 - 1.31 (m, 5 H)。赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (KBr): 2930, 1632, 1552, 1496, 1453, 1389, 1180, 1048, 946, 800, 746, 698。

40

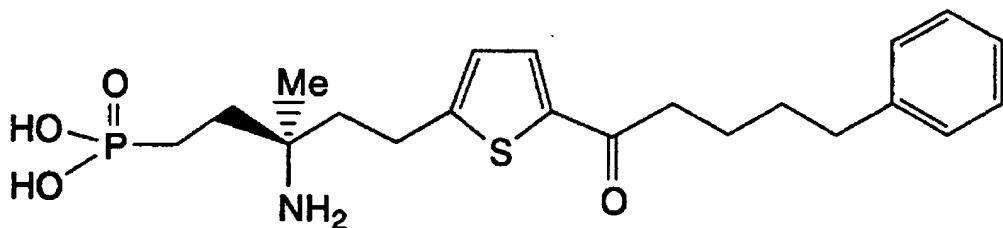
マススペクトル (FAB), m/z: 408 ((M + H)<sup>+</sup>)。

## (実施例 4)

(3R) - アミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

## 【0247】

## 【化 15】



## 【0248】

(a)

(2R)-t-ブトキカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブタナール

10

参考例10で得られた(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール637mg(1.84mmol)を塩化メチレン(18mL)に溶解し、ジ-t-ブチルジカルボネート492mg(2.26mmol)およびトリエチルアミン5.61mL(6.80mmol)を加え、室温で20時間攪拌した。減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製して、N-Boc体[(2R)-t-ブトキカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール]678mg(83%)を得た。

20

## 【0249】

得られたN-Boc体673mg(1.51mmol)を塩化メチレン(15mL)に溶解し、1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンズイオドキソール-3(1H)-オン(Dess-Martin試薬)965mg(2.28mmol)を加え、窒素雰囲気下、室温で1時間攪拌した。減圧下濃縮し、反応液に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、過剰の試薬を分解した後、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和重曹水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/1)により精製して、標記化合物677mg(100%)を得た。

30

## 【0250】

核磁気共鳴スペクトル(400MHz、CDCl<sub>3</sub>)、δ: 9.35(s, 1H), 7.49(d, 1H, J=4.4Hz), 7.29-7.25(m, 3H), 7.18-7.15(m, 2H), 6.80(d, 1H, J=4.4Hz), 5.17(br s, 1H), 2.87-2.79(m, 1H), 2.84(t, 2H, J=6.8Hz), 2.75-2.68(m, 1H), 2.65(t, 2H, J=6.8Hz), 2.40(m, 1H), 2.15(ddd, 1H, J=5.9Hz, 10.8Hz, 14.3Hz), 1.82-1.66(m, 4H), 1.45(s, 9H), 1.38(s, 3H)。

マススペクトル(FAB<sup>+</sup>)、m/z: 444((M+H)<sup>+</sup>)。

## 【0251】

(b)

(3R)-t-ブトキカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ペンテニルホスホン酸ジエチルエステル

60%水素化ナトリウム70.1mg(1.75mmol)をテトラヒドロフラン(3mL)に懸濁し、氷冷下、テトラエチルメチレンジホスホネート0.43mL(1.73mmol)を5分間要して加え、その後室温にて1時間攪拌した。次いで、実施例4(a)得られた(2R)-t-ブトキカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フ

50

エニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] -1-ブタナール 508 mg (1. 13 mol) をテトラヒドロフラン (7 mL) に溶解した溶液を氷冷下、5 分間要して加え、同温度にて 10 分間攪拌した。反応液に酢酸 0.10 mL (1. 75 mmol) を加えて中和した後、減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル) により精製して、標記化合物 614 mg (94%) を得た。

## 【0252】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ : 7.50 (d, 1 H, J = 3.9 Hz), 7.29-7.25 (m, 3 H), 7.19-7.16 (m, 2 H), 6.81 (d, 1 H, J = 3.9 Hz), 6.76 (dd, 1 H, J = 17.8 Hz, 22.5 Hz), 5.72 (dd, 1 H, J = 17.8 Hz, 17.8 Hz), 4.58 (br s, 1 H), 4.15-4.02 (m, 4 H), 2.86-2.77 (m, 4 H), 2.65 (t, 2 H, J = 7.1 Hz), 2.33-2.24 (m, 1 H), 2.06 (br s, 1 H), 1.82-1.67 (m, 4 H), 1.43 (s, 9 H), 1.41 (s, 3 H), 1.33 (t, 3 H, J = 6.8 Hz)。

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>) , m/z : 580 ((M+H)<sup>+</sup>)。

## 【0253】

20

(c)

(3R) - t-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] ペンチルホスホン酸 ジエチルエステル 10% パラジウム-炭素 (50% 含水) 95.3 mg をメタノール (1 mL) に懸濁し、実施例 4 (b) で得られた (3R) - t-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] -1-ペンテニルホスホン酸 ジエチルエステル 508 mg (0.88 mmol) をメタノール (8 mL) に溶解した溶液を加え、水素雰囲気下、50°C で 40 時間攪拌した。反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過した後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/3 ~ 酢酸エチル) により精製して、標記化合物 408 mg (収率 80%) を得た。

30

## 【0254】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ : 7.51 (d, 1 H, J = 3.6 Hz), 7.29-7.25 (m, 3 H), 7.19-7.15 (m, 2 H), 6.81 (d, 1 H, J = 3.6 Hz), 4.37 (br s, 1 H), 4.15-4.05 (m, 4 H), 2.86-2.80 (m, 4 H), 2.65 (t, 2 H, J = 7.1 Hz), 2.30-2.12 (m, 2 H), 1.94-1.86 (m, 1 H), 1.82-1.66 (m, 7 H), 1.43 (s, 9 H), 1.33 (t, 3 H, J = 6.8 Hz), 1.21 (s, 3 H)。

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>) , m/z : 580 ((M+H)<sup>+</sup>)。

40

## 【0255】

(d)

(3R) - アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] ペンチルホスホン酸

実施例 4 (c) で得られた (3R) - t-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) チオフェン-2-イル] ペンチルホスホン酸ジエチルエステル 130 mg (0.22 mmol) を塩化メチレン (2.2 mL) に懸濁し、臭化トリメチルシラン 0.30 mL (0.22 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で 4 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去した後、残渣に含水エタノールを加えて希釈し、これに

50

アンモニア水溶液および酢酸を加えて pH 3 として結晶を析出させた。析出結晶をろ取し、水およびエタノールで洗浄後、乾燥して、標記化合物 82. 1 mg (収率 85 %) を得た。

## 【0256】

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>D), δ: 7.67 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 7.26–7.22 (m, 2H), 7.18–7.12 (m, 3H), 6.97 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 2.98 (t, 2H, J = 8.8 Hz), 2.93 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.3–2.07 (m, 4H), 2.06–1.93 (m, 2H), 1.80–1.65 (m, 4H), 1.46 (s, 3H)。マススペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z: 424 ((M+H)<sup>+</sup>)。

## 【0257】

(参考例 1)

(4R)–メチル–4–[2–(チオフェン–2–イル)エチル]オキサゾリジン–2–オン

(a)

(2R)–t–ブトキシカルボニルアミノ–3–ヘキサノイルオキシ–2–メチル–1–プロパノール

2–t–ブトキシカルボニルアミノ–2–メチル–1, 3–プロパンジオール 20.0 g (97.4 mmol) をジイソプロピルエーテル 200 ml 中に懸濁し、ヘキサン酸 ピニルエステル 16.3 ml (0.10 mol) 及びリパーゼ [Immobilized lipase from Pseudomonas sp. (TOYOBO; 0.67 U/mg)] 0.8 g を加え、室温で 2 時間激しく攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 10/1~2/1) により精製して、標記化合物 25.0 g (収率 85 %) を無色油状物として得た。

## 【0258】

得られた標記化合物の光学純度は、分析用光学活性 HPLC カラム (ChiralCell OF (ダイセル)、(0.46 cm x 25 cm)、溶出溶媒: ヘキサン/2–プロパノール = 70/30、流速: 0.5 ml/min) で決定した。

## 【0259】

先に溶出されるもの (保持時間: 8.2 分) が 2S 体であり、後から溶出されるもの (保持時間: 10.5 分) が 2R 体であり、この反応における光学純度は 85 % ee であることを確認した。

[\alpha]<sub>D</sub><sub>25</sub> = –8.5 (c 1.86, CHCl<sub>3</sub>)  
核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 4.86 (s, 1H), 4.25 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.19 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 3.86 (brs, 1H), 3.70–3.55 (m, 2H), 2.36 (t, 2H, J = 7.4 Hz), 1.68–1.58 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.40–1.30 (m, 4H), 1.25 (s, 3H), 0.90 (t, 3H, J = 7.0 Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>–1</sup> (液状フィルム) : 3415, 3380, 2961, 2935, 2874, 1721, 1505, 1458, 1392, 1368, 1293, 1248, 1168, 1076。

マススペクトル (FAB), m/z: 304 ((M+H)<sup>+</sup>)。

## 【0260】

(b)

(2R)–t–ブトキシカルボニルアミノ–3–ヘキサノイルオキシ–2–メチル–1–

50

## プロパナール

参考例 1 (a) で得られた (2R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 3 - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパノール 30.7 g (0.10 mol) を塩化メチレン 600 ml に溶解し、モレキュラーシープ 4 Å 220 g 及び塩化クロム酸ピリジニウム 43.6 g (0.20 mol) を氷冷下加え、その後、室温で 2 時間攪拌した。反応液をエーテルで希釈後、濾過した。濾液を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン / 酢酸エチル = 10 / 1 ~ 5 / 1) により精製して、標記化合物 28.8 g (収率 95 %) を無色油状物として得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ: 9.45 (s, 1 H), 5.26 (brs, 1 H), 4.44 (d, 1 H, J = 11.2 Hz), 4.32 (d, 1 H, J = 11.2 Hz), 2.32 (t, 2 H, J = 7.6 Hz), 1.70 - 1.55 (m, 2 H), 1.45 (s, 9 H), 1.38 (s, 3 H), 1.40 - 1.25 (m, 4 H), 0.90 (t, 3 H, J = 7.0 Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (液状フィルム) : 3367, 2961, 2935, 2874, 1742, 1707, 1509, 1458, 1392, 1369, 1290, 1274, 1254, 1166, 1100, 1078。マススペクトル (FAB), m/z : 302 (M+H)<sup>+</sup>。

## 【0261】

(c)

(2R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 1 - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (チオフェン - 2 - イル) - 3 - プテン

臭化 2 - チエニルメチルトリフェニルホスホニウム塩 67.1 g (0.15 mol) をテトラヒドロフラン 750 ml に懸濁し、そこに t - プトキシカリウム 17.2 g (0.15 mol) を加え、室温で、窒素雰囲気下 20 分間攪拌した。反応液へ、テトラヒドロフラン 250 ml に溶解した参考例 1 (b) で得られた (2R) - t - プトキシカルボニルアミノ - 3 - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパナール 23.0 g (76.4 mmol) を氷冷下、滴下し、滴下終了後、氷冷下で 30 分攪拌した。その後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン / 酢酸エチル = 20 / 1) により精製して、標記化合物 27.8 g (収率 96 %) を無色油状物として得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ: 7.32 - 7.26, 7.16 - 7.14 (m, 計 1 H), 7.04 - 7.01, 7.01 - 6.93 (m, 計 2 H), 6.63 (d, 0.5 H, J = 16.0 Hz), 6.60 (d, 0.5 H, J = 13.6 Hz), 6.10 (d, 0.5 H, J = 16.0 Hz), 5.58 (d, 0.5 H, J = 13.6 Hz), 4.94, 4.93 (brs, 計 1 H), 4.40 - 4.10 (m, 2 H), 2.34 (t, 2 H, J = 7.4 Hz), 1.70 - 1.55 (m, 2 H), 1.57, 1.50, 1.44 (s, 計 9 H), 1.40 - 1.25 (m, 7 H), 0.88 (t, 3 H, J = 7.0 Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (液状フィルム) : 3370, 2961, 2933, 1725, 1495, 1456, 1391, 1367, 1247, 1167, 1109, 1100, 1072, 697。

マススペクトル (FAB), m/z : 381 (M<sup>+</sup>)。

## 【0262】

(d)

(4R) - メチル - 4 - [2 - (チオフェン - 2 - イル) エテニル] オキサゾリジン - 2 - オン

20

30

40

50

参考例 1 (c) で得られた (2R) - t - ブトキシカルボニルアミノ - 1 - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (チオフェン - 2 - イル) - 3 - プテン 40.5 g (0.11 mol) をテトラヒドロフラン 150 ml 及びメタノール 150 ml に溶解し、そこに 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 530 ml を氷冷下加え、氷冷下で 30 分及び室温で 1 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮後、水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去し、粗生成物 35.0 g を得た。この粗生成物をテトラヒドロフラン 300 ml に溶解し、t - ブトキシカリウム 17.8 g (0.16 mol) を氷冷下加え、氷冷下で 10 分及び室温で 40 分攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン / 酢酸エチル = 3 / 1 ~ 1 / 1) により精製して、標記化合物 18.0 g (収率 81 %) を白色固体として得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ : 7.34 (d, 0.5 H, J = 5.0 Hz), 7.07 - 6.91 (m, 2 H), 6.74 (d, 0.5 H, J = 16.0 Hz), 6.59 (d, 0.5 H, J = 12.5), 6.17 (brs, 1 H), 6.06 (d, 0.5 H, J = 16.0 Hz), 5.65 (d, 0.5 H, J = 12.5 Hz), 4.41 (d, 0.5 H, J = 8.6 Hz), 4.31 - 4.16 (m, 1.5 H), 1.60 (s, 1.5 H), 1.55 (s, 1.5 H)。 20

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3275, 3110, 2974, 1752, 1391, 1376, 1281, 1169, 1039, 960, 704。

マススペクトル (FAB), m/z : 209 (M<sup>+</sup>)。

#### 【0263】

(e)

(4R) - メチル - 4 - [2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル] オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 1 (d) で得られた (4R) - メチル - 4 - [2 - (チオフェン - 2 - イル) エテニル] オキサゾリジン - 2 - オン 18.0 g (86.0 mmol) をメタノール 150 ml に溶解し、10 % パラジウム - 炭素 4.5 g を加え、水素雰囲気下、10 時間室温で攪拌した。反応液中のパラジウム - 炭素を、シリカゲルを薄く敷いた桐山ロートを用いて濾過し、濾液を減圧下留去した。得られた固体をジエチルエーテルで洗浄後、乾燥して、標記化合物 16.5 g (収率 91 %) を白色固体として得た。 30

#### 【0264】

得られた標記化合物の光学純度は、分析用光学活性 HPLC カラム (Chiralcel OD-H (ダイセル)、(0.46 cm x 25 cm)、溶出溶媒: ヘキサン / 2 - プロパノール = 60 / 40、流速: 0.5 ml/min) を用いて決定した。

#### 【0265】

先に溶出されるもの (保持時間: 16.8 分) が 2S 体であり、後から溶出されるもの (保持時間: 17.6 分) が 2R 体であり、この反応における光学純度は 85 % ee であることを確認した。

[α]<sub>D</sub><sub>25</sub> +5.1 (c 2.4, CHCl<sub>3</sub>)

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) , δ : 7.15 (d, 1 H, J = 5.2, 3.6 Hz), 6.93 (dd, 1 H, J = 3.6 Hz), 6.81 (d, 1 H, J = 8.4 Hz), 5.39 (brs, 1 H), 4.19 (d, 1 H, J = 8.4 Hz), 4.08 (d, 1 H, J = 8.4 Hz), 3.00 - 2.84 (m, 2 H), 2.08 - 1.92 (m, 2 H), 1.42 (s, 3 H)。 50

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3283, 1770, 1399, 1244, 1043, 941, 846, 775, 706, 691。

マススペクトル (EI),  $m/z$  : 211 ( $M^+$ )。

【0266】

この光学純度 85 % ee の (4R) -メチル-4-[2-(チオフェン-2-イル)エチル]オキサゾリジン-2-オン 1.1 g に酢酸エチル 2.5 ml とヘキサン 5.0 ml を加えて、加熱溶解した後、室温で 2 時間放置した。析出した白色結晶を濾取し、乾燥を行い、光学純度 99 % ee の標記化合物を 4.0 g 得た。

$[\alpha]_{D}^{25} +7.8$  (c 2.0, CHCl<sub>3</sub>)。 10

【0267】

(参考例 2)

酢酸 (2R) -アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-プロモチオフェン-2-イル)ブチル エステル

(a)

(2R) -アミノ-2-メチル-4-チオフェン-2-イルブタン-1-オール 1/2 D - (-) - 酒石酸塩

参考例 1 で得られた 85 % ee の (4R) -メチル-4-[2-(チオフェン-2-イル)エチル]オキサゾリジン-2-オン 7.30 g (34.6 mmol) をテトラヒドロフラン 3.5 ml 及びメタノール 7.0 ml に溶解し、氷冷下、5 規定水酸化カリウム水溶液 7.0 ml を加え、80 °C で 2 日間攪拌した。反応液に塩化メチレンを加え、水で洗浄した。塩化メチレン層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣 6.20 g をエタノール 6.0 ml に溶解し、D - (-) - 酒石酸 5.19 g (34.6 mmol) のエタノール 5.0 ml 溶液を加え、析出した沈殿を濾取して、粗製の標記化合物 7.56 g を得た。得られた粗製の目的化合物 7.54 g をエタノール 7.5 ml 及び水 5.0 ml を用いて再結晶を行い、標記化合物 5.89 g (98 % ee) を得た。再度、得られた目的化合物 5.88 g をエタノール 6.0 ml 及び水 5.4 ml を用いて再結晶を行い、標記化合物 5.11 g (収率 57 %, 99.7 % ee) を得た。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3400, 3218, 31

26, 2937, 2596, 1599, 30

1530, 1400, 1124, 1077, 715。

元素分析値: (C<sub>9</sub>H<sub>15</sub>NOS · 0.5C<sub>4</sub>H<sub>4</sub>O<sub>6</sub> として %)

計算値 : C, 50.95; H, 6.61; N, 5.40; S, 12.36

実測値 : C, 50.68; H, 6.91; N, 5.38; S, 12.48

$[\alpha]_{D}^{24} -14$  (c 1.00, H<sub>2</sub>O)。

【0268】

(b)

酢酸 (2R) -アセチルアミノ-2-メチル-4-(チオフェン-2-イル)ブチル エステル

参考例 2 (a) で得られた (2R) -アミノ-2-メチル-4-チオフェン-2-イルブタン-1-オール 1/2 D - (-) - 酒石酸塩 5.11 g (19.6 mmol) に、氷冷下、1 規定水酸化ナトリウム水溶液 3.0 ml を加え、フリーア体にした後、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、(2R) -アミノ-2-メチル-4-チオフェン-2-イルブタン-1-オール 3.55 g (収率 98 %) を得た。得られたフリーア体 1.51 g (8.15 mmol) にピリジン 3.0 ml を加え、そこに、氷冷下、無水酢酸 1.95 ml (20.7 mmol)、4-(ジメチルアミノ)ピリジン 2.00 mg (1.64 mmol) を加えた。窒素雰囲気下、室温で、2 時間半攪拌した。反応液を氷冷下、1 規定塩酸 1.50 ml にあけ、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を 1 規定塩酸及び飽和食塩水で順次洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲル

クロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/1~1/2)により精製し、標記化合物2.15g(収率98%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 1.37(3H, s), 1.93(3H, s), 1.94~2.10(1H, m), 2.10(3H, s), 2.24~2.38(1H, m), 2.85(2H, t, J=8.0Hz), 4.18(1H, d, J=11.6Hz), 4.32(1H, d, J=11.6Hz), 5.39(1H, brs), 6.81(1H, dd, J=1.2, 3.6Hz), 6.92(1H, dd, J=3.6, 5.2Hz), 7.12(1H, dd, J=1.2, 5.2Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr): 3265, 3079, 2933, 2862, 1735, 1638, 1559, 1472, 1441, 1374, 1318, 1241, 1179, 1039, 701, 616。

## 【0269】

(c)

酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-プロモチオフェン-2-イル)ブチルエステル

参考例2(b)で得られた酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-(チオフェン-2-イル)ブチルエステル1.81g(6.70mmol)をジメチルホルムアミド20mLに溶解させ、氷冷下、N-プロモスクシンイミド1.27g(7.11mmol)を加え、窒素雰囲気下、氷冷下で10分間及び室温で一昼夜攪拌した。反応液を水にあけ、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/1~1/2)により精製を行ない、標記化合物2.32g(収率99%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 1.35(3H, s), 1.95(3H, s), 1.95~2.08(1H, m), 2.10(3H, s), 2.24~2.37(1H, m), 2.76(2H, t, J=8.4Hz), 4.15(1H, d, J=11.2Hz), 4.30(1H, d, J=11.2Hz), 5.39(1H, brs), 6.57(1H, d, J=3.6Hz), 6.84(1H, d, J=3.6Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (液状フィルム): 3300, 3076, 2980, 2937, 1740, 1657, 1544, 1466, 1446, 1373, 1242, 1045, 794, 604。

## 【0270】

(参考例3)

5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イン

水素化ナトリウム2.11g(48.4mmol)を無水テトラヒドロフラン60mL中に懸濁させ、氷冷下、ジエチルホスホノ酢酸エチルエステル10.84g(48.4mmol)を滴下し、10分間攪拌した。次いで4-フルオロベンズアルデヒド5.00g(40.3mmol)を無水テトラヒドロフラン60mLに溶解した溶液を同温にて滴下した。反応液を同温度で3時間攪拌した後、氷水中150mLに注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=10/1~3/1)にて精製を行い、4-フルオロ桂皮酸エチルエステルを無色油状物として、6.69g(収率86%)を得た。

## 【0271】

このエステル6.52g(33.6mmol)を酢酸エチル100mL中に溶解し、5%ロジウム/アルミナ1.30gを加え、水素雰囲気下、室温にて8時間攪拌した。反応

混合物をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮し、残渣を無水テトラヒドロフラン30m1中に溶解した。この溶液を氷冷下、水素化アルミニウムリチウム1.26g(33.2mmol)を無水テトラヒドロフラン60m1に懸濁させたものに滴下した。反応混合物を同温にて30分間攪拌後、飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、さらに室温で10分間攪拌した。混合物をセライト濾過し、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=5/1~1/1)にて精製を行い、4-フルオロフェニルプロパン-1-オールを無色油状物として、4.86g(收率95%)得た。

## 【0272】

10

得られた4-フルオロフェニルプロパン-1-オール4.83g(31.3mmol)を塩化メチレン50m1中に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン6.55m1(47.0mmol)及びメタンスルホニルクロリド2.91m1(37.6mmol)を加え、窒素雰囲気下、同温度で30分間攪拌した。反応混合物を塩化メチレン50m1で希釈し、氷冷した10%塩酸及び飽和食塩水で順次洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をアセトン100m1中に溶解した。次いで沃化ナトリウム9.39g(62.6mmol)を加え、窒素雰囲気下、50℃にて2時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル250m1で希釈後、10%チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=5/1~2/1)にて精製を行い、4-フルオロフェニル-1-ヨードプロパンを淡黄色油状物として、7.12g(收率86%)得た。

20

## 【0273】

ヘキサメチルホスホラミド20m1中にナトリウムアセチリド(18%キシレン懸濁液)50m1を加え、氷冷下、先に得られた4-フルオロフェニル-1-ヨードプロパン7.00g(26.5mmol)を無水ジメチルホルムアミド20m1に溶解した溶液を加えた。反応混合物を室温にて、2時間攪拌した。氷冷下に氷水を注意深く注ぎ、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン)にて精製を行い、標記化合物を無色油状物として、2.67g(收率62%)得た。

30

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 1.82(2H, m), 1.99(1H, t, J=2.6Hz), 2.19(2H, m), 2.71(2H, t, J=7.5Hz), 6.97(2H, m), 7.14(2H, m)。

マススペクトル(EI), m/z: 162(M<sup>+</sup>)。

## 【0274】

## (参考例4)

5-フェニルペント-1-イン

参考例3と同様に、3-フェニル-1-ヨードプロパン及びナトリウムアセチリドを用いて、標記化合物を得た。

40

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 1.81-1.89(2H, m), 1.99(1H, t, J=2.8Hz), 2.21(2H, dt, J=2.8, 7.6Hz), 2.74(2H, t, J=7.6Hz), 7.16-7.23(3H, m), 7.26-7.32(2H, m)。

マススペクトル(EI), m/z: 144(M<sup>+</sup>)。

## 【0275】

## (参考例5)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)]

50

## チオフェン-2-イル] プタン-1-オール

(a)

2-メチル-2-(2-チエニル)エチルマロン酸 ジエチル エステル

水素化ナトリウム (5.5%) 18.8 g (0.43 mol) をジメチルホルムアミド (200 ml) 中に懸濁させ、氷冷下、メチルマロン酸 ジエチル エステル 50.0 g (0.29 mol) を30分間かけてゆっくりと加え、さらに30分攪拌した。次いで、2-(2-ヨードエチル)チオフェン 75.2 g (0.32 mol) をジメチルホルムアミド (200 ml) に溶かした溶液を窒素雰囲気下、15分かけて加え、さらに室温にて4時間攪拌した。反応混合物を氷冷した10%塩酸 (500 ml) 中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 10/1 ~ 5/1) にて精製を行い、標記化合物を無色油状物として、53.1 g (収率65%) 得た。  
10

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 2986, 1726, 1271, 1252。

マススペクトル (FAB), m/z : 285 ((M+H)<sup>+</sup>)。

【0276】

(b)

2-メチル-2-(2-チエニル)エチルマロン酸 モノーエチル エステル

参考例5(a)で得られた2-メチル-2-(2-チエニル)エチルマロン酸 ジエチル エステル 52.7 g (0.19 mol) をエタノール (240 ml) 及び水 (80 ml) 中に溶解し、氷冷下、水酸化カリウム 11.4 g (0.20 mol) を加え、同温度で2時間攪拌した。さらに1時間ごとに水酸化カリウム 5.7 g (0.1 mol) を3回加え、計6時間攪拌した。水 (300 ml) 及び氷冷した10%塩酸 (500 ml) を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 2/1 ~ 0/1) にて精製を行い、標記化合物を淡黄色油状物として、28.6 g (収率60%) 得た。  
20

【0277】

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 2987, 1732, 1712, 1251, 1109。

マススペクトル (FAB), m/z : 257 ((M+H)<sup>+</sup>)。

【0278】

(c)

2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(2-チエニル)ブタン酸 エチル エステル

参考例5(b)で得られた2-メチル-2-(2-チエニル)エチルマロン酸 モノーエチル エステル 19.0 g (74.3 mmol) をベンゼン (450 ml) 中に溶解し、トリエチルアミン 11.4 ml (81.7 mmol) 及びジフェニルリン酸アジド 17.6 ml (81.7 mmol) を加え、室温にて10分間攪拌後、さらに80°Cにて1時間半攪拌した。次いでメタノール 60.3 ml (1.49 mol) を同温にて30分かけてゆっくりと滴下し、さらに同温度で8時間攪拌した。反応混合物を水 (500 ml) 中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 8/1 ~ 4/1) にて精製を行い、標記化合物を無色油状物として、14.7 g (収率69%) 得た。  
40

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$  : 7.11 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.90 (1H, dd, J = 5.1, 3.5 Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.5 Hz), 5.69 (1H, brs), 4.19 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.66 50

(3 H, s), 2.84 (2 H, dd, J = 10.5, 10.5 Hz), 2.64 (2 H, m), 2.20 (2 H, dd, J = 10.5, 8.4 Hz), 1.61 (3 H, s), 1.28 (3 H, t, J = 7.3 Hz)。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 3417, 2987, 1719, 1503, 1453, 1081。

マススペクトル (FAB), m/z : 286 ((M+H)<sup>+</sup>)。

【0279】

(d)

2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(2-チエニル)ブタン-1-オール  
参考例5(c)で得られた2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(2-チエニル)ブタン酸エチルエステル 14.7 g (51.6 mmol)をエタノール(150 ml)及びテトラヒドロフラン(100 ml)中に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム 5.07 g (0.13 mol)及び塩化リチウム 5.68 g (0.13 mol)を加え、窒素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。翌朝、同様にして、水素化ホウ素ナトリウム 5.07 g (0.13 mol)及び塩化リチウム 5.68 g (0.13 mol)を加え、窒素雰囲気下、室温でさらに一晩攪拌した。これと同様の操作をさらに2日間行った。反応混合物を氷冷した10%塩酸(500 ml)中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=2/1~1/5)にて精製を行い、標記化合物を白色結晶として、11.7 g (収率93%)を得た。

10

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3406, 3244, 1687, 1562, 1264, 1089。

マススペクトル (FAB), m/z : 244 ((M+H)<sup>+</sup>)。

元素分析値: (C<sub>11</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>3</sub>Sとして%)

計算値: C : 54.30, H : 7.04, N : 5.76, S : 13.18

実測値: C : 54.18, H : 6.98, N : 5.78, S : 13.34。

20

【0280】

(e)

2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(5-プロモチオフェン-2-イル)ブタン-1-オール

参考例5(d)で得られた2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(2-チエニル)ブタン-1-オール 11.7 g (48.0 mmol)をジメチルホルムアミド(120 ml)中に溶解し、氷冷下、N-プロモスクシンイミド 10.8 g (60.8 mmol)を加え、窒素雰囲気下、室温にて4時間攪拌した。反応混合物を氷冷した10%塩酸(300 ml)中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1~1/3)にて精製を行い、標記化合物を淡黄色油状物として、12.4 g (収率80%)を得た。

40

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ : 6.84 (1H, d, J = 3.7 Hz), 6.57 (1H, d, J = 3.7 Hz), 4.80 (1H, brs), 3.68 (2H, m), 3.64 (3H, s), 2.80 (2H, m), 1.9-2.2 (2H, m), 1.24 (3H, s)。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 3627, 3436, 2956, 1722, 1711, 1513, 1259, 1087, 1048。

50

マススペクトル (FAB),  $m/z$  : 322 ( $(M+H)^+$ )。

【0281】

(f)

4-[2-(5-ブロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン参考例5(e)で得られた2-メトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(5-ブロモチオフェン-2-イル)ブタン-1-オール12.4g(38.6mmol)をジメチルホルムアミド(125ml)中に溶解し、冰冷下、窒素雰囲気下にカリウムt-ブトキシド6.50g(57.9mmol)を加え、さらに同温にて3時間攪拌した。反応混合物を冰冷した10%塩酸(300ml)中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧濃縮し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1~1/2)にて精製を行い、標記化合物を白色結晶として、10.7g(収率95%)得た。

10

【0282】

核磁気共鳴スペクトル( $400\text{MHz}$ ,  $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$ : 6.86(1H, d,  $J$  = 3.7Hz), 6.58(1H, d,  $J$  = 3.7Hz), 5.73(1H, brs), 4.18(1H, d,  $J$  = 8.6Hz), 4.08(1H, d,  $J$  = 8.6Hz), 2.84(2H, m), 1.94(2H, m), 1.41(3H, s)。

赤外吸収スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3211, 1749, 120399, 1037, 798。

マススペクトル(FAB),  $m/z$  : 290 ( $(M+H)^+$ )。

元素分析値; ( $\text{C}_{10}\text{H}_{12}\text{NO}_2\text{SBr}$ として%)

計算値: C : 41.39, H : 4.17, N : 4.83, S : 11.05, Br : 27.54

実測値: C : 41.36, H : 4.04, N : 4.82, S : 11.08, Br : 27.29。

【0283】

(g)

(4R)-[2-(5-ブロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン及び(4S)-[2-(5-ブロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン

30

参考例5(f)で得られた4-[2-(5-ブロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オンを分取用光学活性HPLCカラム(Chiralcel OD 1OD、ダイセル)を用いて光学分割を行った(カラム, Chiralcel OD (2cmφ x 25cm); 溶出溶媒: ヘキサン/2-ブロパノール=70/30、流速: 5ml/分)。先に溶出されるもの(保持時間: 55分)が4S体であり、後から溶出されるもの(保持時間: 77分)が4R体であった。尚、絶対配置についてはX線結晶構造解析により決定した。

(4S)体;  $[\alpha]_D^{24} -4.2$  (c 1.03, メタノール)

40

(4R)体;  $[\alpha]_D^{24} +4.2$  (c 1.00, メタノール)。

【0284】

(h)

(4R)-[2-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン

参考例5(g)で得られた(4R)-[2-(5-ブロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン450mg(1.55mmol)をジメチルホルムアミド4.5mlに溶解させ、5-シクロヘキシルペント-1-イン(50%キシレン溶液)1.40g(4.65mmol)、トリエチルアミン2.16ml(15.5mmol)、ヨウ化銅(I)30mg(0.16mmol)及びジクロ

50

ロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム109 mg (0.16 mmol)を加え、窒素雰囲気下、80℃で2時間攪拌した。反応液を水にあけ、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1~3/2)により精製して、標記化合物456 mg (収率82%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400 MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 6.92 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.63 (1H, d, J = 3.6 Hz), 5.45 (1H, brs), 4.18 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.07 (1H, d, J = 8.6 Hz), 2.78-2.90 (2H, m), 2.38 (2H, t, J = 7.2 Hz), 1.92-2.00 (2H, m), 1.55-1.75 (7H, m), 1.40 (3H, s), 1.10-1.35 (6H, m), 0.83-0.95 (2H, m)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr): 3450, 2926, 2852, 1758, 1382, 1046。

#### 【0285】

(i)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール

20

参考例5(h)で得られた(4R)-[2-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン456 mg (1.27 mmol)をテトラヒドロフラン1 ml及びメタノール2 mlに溶解させ、氷冷下、5規定水酸化カリウム水溶液2 mlを加え、18時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー[溶出溶媒:(塩化メチレン/メタノール=20/1)、(塩化メチレン/メタノール/アンモニア水=10/1/0.1)]により精製して、標記化合物353 mg (収率83%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400 MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 6.92 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.62 (1H, d, J = 3.5 Hz), 3.37 (1H, d, J = 10.5 Hz), 3.32 (1H, d, J = 10.5 Hz), 2.75-2.90 (2H, m), 2.38 (2H, t, J = 7.1 Hz), 1.52-1.79 (9H, m), 1.12-1.33 (6H, m), 1.11 (3H, s), 0.81-0.96 (2H, m)。赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>): 2925, 2852, 1449, 1041。

マススペクトル(FAB), m/z: 334 ((M+H)<sup>+</sup>)。

元素分析値: (C<sub>20</sub>H<sub>31</sub>NOS·0.3H<sub>2</sub>Oとして%)

計算値: C: 70.87, H: 9.40, N: 4.13, S: 9.46

40

実測値: C: 70.83, H: 9.21, N: 4.22, S: 9.64

[α]<sub>D</sub><sup>24</sup> -2.0 (c 0.60, メタノール)。

#### 【0286】

(参考例6)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール マレイン酸塩

4-[2-(5-プロモチオフェン-2-イル)]エチル-4-メチルオキサゾリジン-2-オン及び4-シクロヘキシルオキシブト-1-インを出発原料として用い、参考例5(h)及び参考例5(i)と同様に反応して、次いでマレイン酸塩にして標記化合物(収率50%)を得た。

率43%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CD<sub>3</sub>OD), δ: 6.93(1H, d, J = 3.6Hz), 6.73(1H, d, J = 3.6Hz), 6.25(2H, s), 3.57-3.67(3H, m), 3.51(1H, d, J = 11.6Hz), 3.32-3.42(1H, m), 2.78-2.95(2H, m), 2.63(2H, t, J = 6.7Hz), 1.50-2.10(7H, m), 1.17-1.37(8H, m)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3394, 2932, 2858, 1583, 1506, 1386, 1367, 1194, 110104。

#### 【0287】

(参考例7)

酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチルエステル

参考例2で合成した酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-ブロモチオフェン-2-イル)ブチルエステル1.60g(4.59mmol)をジメチルホルムアミド16mLに溶解させ、5-フェニルペント-1-イン1.99g(13.8ミリモル)、トリエチルアミン6.40mL(45.9ミリモル)、ヨウ化銅(I)175mg(0.92ミリモル)及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム322mg(0.46ミリモル)を加え、窒素雰囲気下80℃で2時間攪拌した。反応液を水にあけ、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=2/1~2/3)により精製して、標記化合物1.41g(収率75%)を得た。

核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>), δ: 1.36(3H, s), 1.85-2.05(3H, m), 1.94(3H, s), 2.10(3H, s), 2.25-2.35(1H, m), 2.43(2H, t, J = 7.0Hz), 3.70-3.80(4H, m), 4.17(1H, d, J = 11.2Hz), 5.38(1H, brs), 6.64(1H, d, J = 3.6Hz), 6.94(1H, d, J = 3.6Hz), 7.15-7.42(5H, m)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 3443, 2946, 2862, 1737, 1681, 1511, 1374, 1251, 1042。

#### 【0288】

(参考例8)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

参考例7で得られた酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(6-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル337mg(0.82ミリモル)をメタノール17mLに溶解させ、10%パラジウム-炭素170mgを加え、水素雰囲気下、室温で16時間攪拌した。セライトで触媒を濾去後、濾液を減圧下留去し、酢酸(2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブチル318mg(収率93%)を得た。得られた酢酸ブチルエステル298mg(0.72ミリモル)をテトラヒドロフラン、メタノール及び水の混合液(1/1/1)6mL中に溶解し、水酸化リチウム・一水和物301mg(7.17mmol)を加え、50℃で6時間攪拌した。反応液を水にあけ、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。残渣243mgをメタノールに溶解し、シュウ酸65mg(0.72mmol)を加え、析出した結晶50

を濾取し、標記化合物を白色結晶として 251 mg (収率 83%) 得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD), δ: 1.31 (3H, s), 1.32-1.42 (2H, m), 1.58-1.70 (4H, m), 1.88-2.08 (2H, m), 2.59 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.74 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.75-2.91 (2H, m), 3.52 (1H, d, J = 11.6 Hz), 3.61 (1H, d, J = 11.6 Hz), 6.56 (1H, d, J = 3.3 Hz), 6.63 (1H, d, J = 3.3 Hz), 7.09-7.17 (3H, m), 7.19-7.27 (2H, m)。赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3458, 3134, 2910, 29, 2855, 2595, 1724, 1642, 1543, 1219, 710 cm<sup>-1</sup>。

#### 【0289】

(参考例 9)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

参考例 7 で得られた酢酸 (2R)-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブチル エステル 1.40 g (3.40 mmol) をテトラヒドロフラン、メタノール及び水の混合液 (1/1/1) 14 mL 中に溶解し、水酸化リチウム・一水和物 1.43 g (34.0 mmol) を加え、50 °C で 4 時間攪拌した。反応液を水にあけ、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウム (1/0.1) により精製して、(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール 1.11 g (収率 100%) を得た。得られたブタン-1-オール 360 mg (1.10 mmol) をメタノールに溶解し、シュウ酸 99 mg (1.10 mmol) を加え、析出した結晶をメタノールより再結晶を行ない、標記化合物を白色結晶として 394 mg (収率 86%) 得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD), δ: 1.31 (3H, s), 1.82-2.10 (4H, m), 2.40 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.75 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.80-2.95 (2H, m), 3.52 (1H, d, J = 11.5 Hz), 3.61 (1H, d, J = 11.5 Hz), 6.73 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.94 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.13-7.30 (5H, m)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3383, 3106, 3026, 2980, 2942, 2622, 2514, 1721, 1609, 1539, 1198, 699。

マススペクトル (FAB), m/z : 328 ((M+H)<sup>+</sup>) (Free 体)。

元素分析値; (C<sub>20</sub>H<sub>25</sub>NOS·C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>O<sub>4</sub>·0.2H<sub>2</sub>Oとして%)

計算値: C, 62.75; H, 6.55; N, 3.32; S, 7.61

実測値: C, 62.50; H, 6.29; N, 3.39; S, 7.70。

[\alpha]<sub>D</sub><sup>25</sup> -0.9 (c 1.00, メタノール)。

#### 【0290】

(参考例 10)

(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペントノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

参考例 9 の第一工程で得られた (2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩 387 mg (1.18 ミリモル) をメタノール 4 mL に溶解させ、6 満定硫酸 4 mL を加え、4 時間加熱還流した。反応液を 0 °C に冷却後、1 満定水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性

(pH 1.4) にした後、塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (Chromatograph NH (100-200 mesh)) (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 1/0 ~ 50/1) により精製して、(2R)-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール 336 mg (収率 82%) 得た。これをメタノールに溶解し、シュウ酸 88 mg (0.97 mmol) を加え、得られた結晶をメタノールより再結晶を行ない、標記化合物を白色結晶として 332 mg (収率 78%) 得た。

核磁気共鳴スペクトル (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD), δ: 1.19 (3H, s), 1.55-1.67 (4H, m), 1.80-1.98 (2H, m), 2.60 (2H, t, J = 6.7 Hz), 2.83-2.96 (4H, m), 3.40 (1H, d, J = 11.3 Hz), 3.47 (1H, d, J = 11.3 Hz), 7.00 (1H, d, J = 3.7 Hz), 7.13-7.22 (3H, m), 7.23-7.31 (2H, m), 7.80 (1H, d, J = 3.7 Hz)。

赤外吸収スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr): 3126, 2942, 2657, 1915, 1718, 1649, 1609, 1547, 1445, 1205, 700

マススペクトル (FAB), m/z: 346 ((M+H)<sup>+</sup>) (フリーアイド)。

元素分析値; (C<sub>20</sub>H<sub>27</sub>NO<sub>2</sub>S · C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>O<sub>4</sub> · 0.5H<sub>2</sub>Oとして%)

20

計算値: C, 59.44; H, 6.80; N, 3.15; S, 7.21

実測値: C, 59.62; H, 6.53; N, 3.31; S, 7.43。

#### 【0291】

##### (試験例 1)

ラットHvGR (Host versus Graft Reaction) に対する抑制活性の測定

(1) 2系統のラット [Lewis (雄、6週齢、日本チャールス・リバー株式会社) とWKAH/Hkm (雄、7週齢、日本エスエルシー株式会社)] を使用した。1群5匹のラット (宿主) を用いた。

(2) WKAH/Hkm ラットまたは Lewis ラットの脾臓から脾臓細胞を単離し、RPMI 1640 培地 (ライフ テクノロジー社製) で 1 × 10<sup>8</sup> 個/m<sup>1</sup> 濃度に浮遊した。Lewis ラットの両後肢足蹠皮内に、WKAH/Hkm ラットまたは Lewis ラットの脾臓細胞浮遊液 0.1 ml (脾臓細胞数として 1 × 10<sup>7</sup> 個) を注射した。

(3) 試験化合物を 5% SBE-β-CD 水溶液 (SBE: Sulfolobutyl Ether) に溶解し、WKAH/Hkm ラット脾臓細胞を注射された Lewis ラットに、ラットの体重 1 kg 当たり 5 ml の割合で、1日1回、脾臓細胞注射日から 4 日間連日で経口投与した。なお、同系群 (Lewis ラット脾臓細胞を注射された Lewis ラット群) と対照群 (WKAH/Hkm ラット脾臓細胞を注射され、検体を投与されない Lewis ラット) には、検体の代わりに 5% SBE-β-CD 水溶液を経口投与した。

(4) 各個体の膝窩 (popliteal) リンパ節重量から同系群の平均膝窩リンパ節重量を引き (「HvGR による膝窩リンパ節重量」)、対照群の平均「HvGR による膝窩リンパ節重量」に対する化合物投与群の各個体の「HvGR による膝窩リンパ節重量」から抑制率を算出した。化合物の抑制活性は、化合物の投与量と抑制率から最小二乗法を用いて算出した ID<sub>50</sub> 値 (mg/kg) で表示した。

40

#### 【0292】

##### 【表3】

---

化合物	HvGR ID <sub>50</sub> 値 (mg/kg)
-----	---------------------------------

---

実施例 1	0.0878
-------	--------

---

本試験の結果、本発明の化合物は優れた抑制活性を示した。

【0293】

10

【発明の効果】

本発明の一般式(I)を有するリン酸又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有し、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、尋常、Sydenham舞蹈病、全身性硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、真菌、マイコプラズマ、ウイルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞蹈病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患（特に好適には、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患）の、温血動物用（特に、ヒト用）の予防剤若しくは治療剤（特に、治療薬）として有用である。

20

30

---

フロントページの続き

(72)発明者 下里 隆一  
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内  
(72)発明者 奈良 太  
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内  
F ターム(参考) 4C086 AA02 AA03 DA34 NA14 ZB08  
4H050 AA01 AB22 AB23 AB25 AB27 AB28

【要約の続き】

【選択図】 なし。